

明細書

シンナモイル誘導体およびその用途

技術分野

本発明は、シンナモイル誘導体およびその用途に関する。

5

背景技術

肝硬変、間質性肺疾患、慢性腎不全（又は慢性腎不全に陥る疾患）、炎症後の過形成痕跡、術後の癒痕や熱傷性癒痕、強皮症、動脈硬化、高血圧等の疾患や異状においては、コラーゲンに代表されるような細胞外マトリックスの過度の集積により

10 組織が線維化して硬化し、その結果、臓器・組織の機能低下や癒痕形成等に至る。このような細胞外マトリックスの過度の集積は、コラーゲン等の生合成と分解とのバランスの破綻に基づくコラーゲンの産生亢進により導かれる。実際、線維化した組織においては、コラーゲン遺伝子、特にI型コラーゲン遺伝子の発現量が増加していることが観察されている [例えば、J. Invest. Dermatol. ,

15 94, 365, (1990)、及びProc. Natl. Acad. Sci. USA, 88, 6642, (1991)]。また、線維化した組織においては、サイトカインの1種であるTGF- β の量が上昇していることも観察されている [例えば、J. Invest. Dermatol. , 94, 365, (1990)、及びProc. Natl. Acad. Sci. USA, 88, 6642, (1991)]

20 。TGF- β は、I型コラーゲン遺伝子の発現量を増加させ、コラーゲンの産生亢進、ひいては、組織の線維化に関与していることが示されている [例えば、Lab. Invest. , 63, 171, (1990)、及びJ. Invest. Dermatol. , 94, 365, (1990)]。さらに、組織線維化のモデル動物に対し、抗TGF- β 抗体や可溶性抗TGF- β 受容体を投与することにより、組

25 織の線維化が改善され、それに伴い組織機能が改善されることが明らかにされており [例えば、Diabetes, 45, 522-530, (1996)、Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 96, 12719-12724, (1999) 及びProc. Natl. Acad. Sci. USA, 97, 8015-8

020, (2000)]、またTGF- β の細胞内シグナル伝達に対して抑制的に働く化合物を投与することにより、組織の線維化が改善され、それに伴い組織機能が改善されることも知られている[例えば、Autoimmunity, 35, 277-282, (2002)、J. Hepatol., 37, 331-339, (2002)、及びLife Sci., 71, 1559-1606, (2002)]。

そこで、組織におけるI型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させ、コラーゲン蓄積量を低下させることにより、組織の線維化を改善させる薬剤（即ち、コラーゲン蓄積抑制剤や線維症治療剤）の開発・提供が切望されている。

10

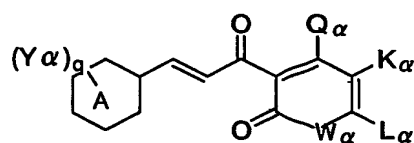
発明の開示

本発明者らは、かかる状況の下、鋭意検討した結果、下記の式(I)～(V)、(VII)、(VIII)、(X)、(XI)、(XIII)、(XV)～(XIV)で示される化合物がI型コラーゲン遺伝子の転写を抑制する能力を有することを見出し、本発明に至った。

15

即ち、本発明は、

1. 式(I)



(I)

[式中、

1. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表し、(Y α)_qにおいて、Y α は、炭素原子上の置換基であって、下記のX₀群又はY₀群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表して、qが2以上のとき、Y α は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なるY α は、Z₀群の基をなしてA環と縮環してもよい。

20

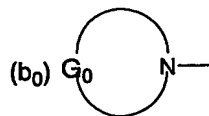
(1) X_0 群:

M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

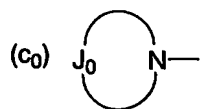
25 (2) Y_0 群:

$M_{b0}-R_d$ -基 [M_{b0} は、 M_{c0} -基 (M_{c0} は、 $M_{d0}-R_d'$ -基 (M_{d0} は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい

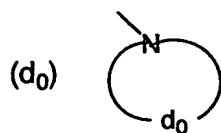
5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



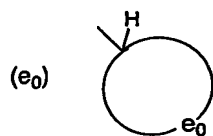
(b₀)-基 ((b₀)において、G₀は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



(c₀)-基 ((c₀)において、J₀は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5-7員環をなす。)、



10 (d₀)-基 {d₀は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 {R₁は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基 (R₂は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、B₁は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。}、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} 又は



(e₀)-基 {e₀は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、-N

R_1 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。)を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。)を表す。)、 $M_{c_0}-B_a$ -基 (M_{c_0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO-O$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}O-CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}O-CO-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_{c_0} 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_{c_0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-SO_2-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。))又は $M_{c_0}R_eN-SO_2$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、A環と縮環する基である。

I I. Q_a は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

I I I. W_a は、酸素原子又は $-NT_a$ -基 (T_a は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。)を表す。

I V. K_a 及び L_a は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、 K_a と L_a とは、置換基を有してもよいC1-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC1-C10アルケニレン基をなすことがある。

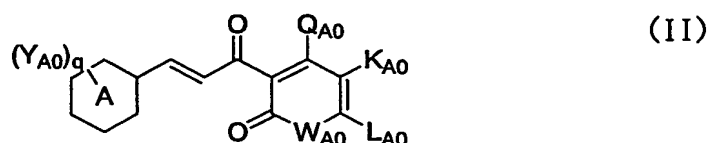
但し、A環がベンゼン環で、 W_a が酸素原子で、 L_a がメチル基で、 K_a が水素

- 原子で、 Q_A がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A がメチル基で、 K_A が水素原子で、 Q_A がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_A がハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C4ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）ではなく、またAがベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A 及び K_A が1，3-ブタジエニレン基をなし、 Q_A がメトキシ基のとき、 q が1で Y_A がメトキシ基又はエトキシ基ではなく、またAがベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A 及び K_A が1，3-ブタジエニレン基をなし、 Q_A が水酸基のとき、 q が1で Y_A がエトキシ基ではない。

- 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

2. 式 (II)



- 20 [式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_{A0})_q$ において、 Y_{A0} は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_0 群及び Y_0 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき

、 Y_{A0} は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

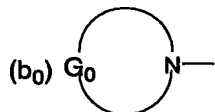
(1) X_0 群：

- M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_{e'}N-R_d$ -基 (R_e 及び $R_{e'}$ は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 $R_{e'}$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_{e'}-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_{e'}N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_{e'}N-CO-NR_{e''}-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び $R_{e''}$ は、同一又は相異なり、 R_e 及び $R_{e'}$ は、前記と同一の意味を表し、 $R_{e''}$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_{e'}N-C(=NR_{e''})-NR_{e'''}-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 、 $R_{e''}$ 及び $R_{e'''}$ は、同一又は相異なり、 R_e 、 $R_{e'}$ 及び $R_{e''}$ は、前記と同一の意味を表し、 $R_{e'''}$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_{e'}N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

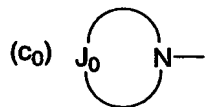
(2) Y_0 群：

$M_{b0}-R_d$ -基 [M_{b0} は、 M_{c0} -基 (M_{c0} は、 $M_{d0}-R_d'$ -基 (M_{d0} は、 M_a -

基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい 6-10 員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい 5-10 員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい 3-10 員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、

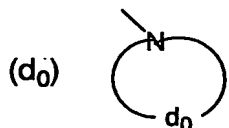


(b₀)-基 ((b₀) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14 員の炭化水素環又は複素環をなす。)、

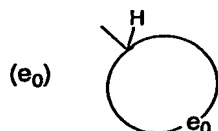


(c₀)-基 ((c₀) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族 5-7 員環をなす。)、

10



(d₀)-基 { d_0 は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又は C3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換された C2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5-12 員の炭化水素環をなす。} 又は



(e_0)-基 { e_0 は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-N$
 R_1 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニ
 ル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。}を表し、 R_d' は、 R_d
 と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。}を表す。}、 $M_{c_0}-B_a$ -基 (M_{c_0}
 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同
 一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO-O$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)
 、 $M_{c_0}O-CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN$ -基 (M_{c_0}
 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び
 R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}O-CO-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は
 、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同
 一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_{c_0} 、 R_e 及び R_e' は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_{c_0} 、
 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-SO_2-NR_e$
 -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)又は $M_{c_0}R_eN-SO_2$ -基
 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味
 を表す。]である。

(3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-
 C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、ス
 ルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又
 は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、A環と縮環す
 る基である。

III. Q_{A_0} は、水酸基、(b_0)-基 (b_0 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カ
 ルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1$
)-基 (m は、0又は1を表し、 R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又
 は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アル
 ケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニ
 ル基又はスルホニル基を表す。)]で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10ア

ルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} を表す。但し、 A_9 が水素原子
 のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7'' - SO_2 - B_c$ -基 (A_7''
 は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 A_8
 $-SO_2 - B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意
 5 味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N - SO_2 - B_c$ -基
 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意
 味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - SO_2 - B_c$ -基 ((b_0)
 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9' - B_c$ -基 (A_9' は、下記の
 A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$
 10 $R_4 - B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基
 を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} - B_3 - B_c$ -基 (B_3 は、カル
 ボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_{c0} 及び B_c は、前記と同
 一の意味を表す。) 又は $M_{c0} - B_c$ -基 (M_{c0} 及び B_c は、前記と同一の意味を表す
 。) である。

15 (1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-
 C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表
 し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ -基 (D_4 は、下記の D_4 群の
 置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ -基 (D_5 は、下記
 20 の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ -基 (D_1
 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 (b_0)
 $-R_4$ -基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表
 す。)、 $(c_0) - R_4$ -基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と
 同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4
 25 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を
 表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4 - SO_2 - R_4$ -基 (A_4 は、 (b_0)
 $-$ 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0) -$ 基 ((c_0) は、前
 記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意

味を表す。)を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4'$ -基 ((b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4'$ -基 ((c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4'$ -基 ((b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4'$ -基 ((c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-

C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。)を表す。]である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基(R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1 N-(O)_k)$ -基(R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基(R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基(A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は NH_2-CS -基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 O S O_2$ -基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

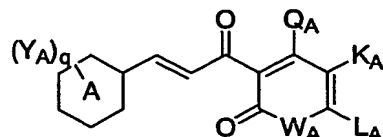
(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基(R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m

- し、 K_{A0} と L_{A0} とは、C1-C10アルキレン基、又は、単数又は同一又は相異なる複数の M_A 基で置換されてもよいC1-C10アルケニレン基をなすことがある。但し、A環がベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} がメチル基で、 K_{A0} が水素原子で、 Q_{A0} がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} がメチル基で、 K_{A0} が水素原子で、 Q_{A0} がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_{A0} がハロゲン原子、又は、ハロゲン原子もしくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C4ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）ではなく、またAがベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} 及び K_{A0} が1，3-ブタジエニレン基をなし、 Q_{A0} がメトキシ基のとき、 q が1で Y_{A0} がメトキシ基又はエトキシ基ではなく、またAがベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} 及び K_{A0} が1，3-ブタジエニレン基をなし、 Q_{A0} が水酸基のとき、 q が1で Y_{A0} がエトキシ基ではない。
- 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]
- で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

3. 式 (III)



(III)

[式中、

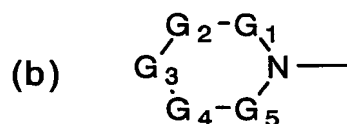
I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_A)_q$ において、 Y_A は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又はY群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_A は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる

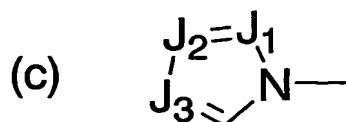
5 Y_A は、Z群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X群： M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、
10 単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH$
15 $=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
20 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
25 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である

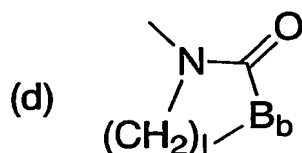
。(2) Y群: M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、
 5 又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、又は、



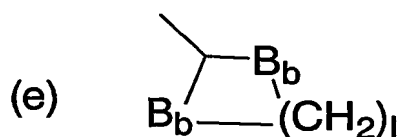
(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重
 10 結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、
 15 、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、



(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基
 20 で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) ー基 (1 は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) ー基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a ー基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ ー基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ ー基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z 群: $-N=C(Y_a)-Y_a'$ ー基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ ー基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ ー基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10 アルキレン基を表す。) である。

III. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9 - B_6 - B_c -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基 (m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。但し、
 5 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7' - SO_2 - B_c$ -基 (A_7' は、下記の A_7' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2 - B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N - SO_2 - B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - $SO_2 - B_c$ -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9' - B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - B_3 - B_c$ -
 10 基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は $M_c - B_c$ -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - R_4 -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。))である。

、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、

5 、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、
10 、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -
20 -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群：水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ 、

一基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、
 5 単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。} を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

- 10 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
 15 又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(iii) D_1 群: ($R_1-(O)_k-$) $A_1 N-(O)_k$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。) である。

- (iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、
 20 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS -基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

- 25 1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲ

ン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - R_4 - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_2 - B_1 - R_4 - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - R_4 - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - R_4 - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - R_4 - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは A_4 - SO_2 - R_4 - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) - 基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c) - 基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)である。

IV. W_A は、酸素原子又は $-NT_A$ - 基 [T_A は、水素原子、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は M_c - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。

V. K_A は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_A は、水素原

子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、
 K_A と L_A とは、C1-C10アルキレン基又は $-C(M_a')=C(M_a'')-C(M_a''')$
 $=C(M_a'''')$ -基 (M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 及び M_a'''' は、同一又は相異なり、 M_a と同一又は相異なり、水素原子又は M_a を表す。)をな
 5 すことがある。

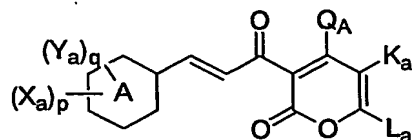
但し、A環がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A がメチル基で、 K_A が水素原
 子で、 Q_A がC1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基又はC3-C10アルキニ
 ルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で
 、 L_A がメチル基で、 K_A が水素原子で、 Q_A がC1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケ
 10 ニルオキシ基又はC3-C10アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_A がハロゲン原子
 、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アル
 キル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基、又は、RB-基 (Rは、C1-
 C10ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。)ではなく、またA
 がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A 及び K_A が1、3-ブタジエニレン基をな
 15 し、 Q_A が水酸基又はC1-C10アルコキシ基のとき、 q が1で Y_A がC1-C10アルコキシ
 基ではない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、
 当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該
 複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲
 20 内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいこと
 を意味するものである。]

で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コ
 ラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

4. 式 (IV)

(IV)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_a)_p$ において、 X_a は、炭素原子上の置換基であって、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、C1-C10アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C10ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_a は同一又は相異なる。

III. $(Y_a)_q$ において、 Y_a は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_1 群又は Y_1 群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_a は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_a は、 Z_1 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X_1 群：

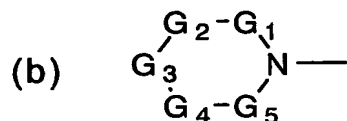
M_a -基 [M_a は、 R_b -基（ R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。）、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基（ R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。）、 HOR_d -基（ R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 R_e-CO-R_d -基（ R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_e-CO-O-R_d$ -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_eO-CO-R_d$ -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基（ R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。

- $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_a -基 (X_a は、前記と同一の意味を表す。)を除く。

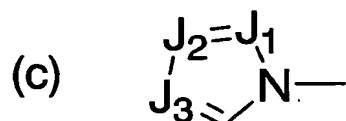
15 (2) Y_1 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は

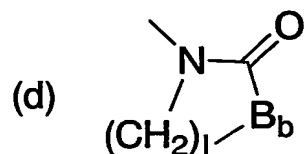


(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、 C_1-C_{10} アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、 C_1-C_{10} アルキル基、 C_3-C_{10} アルケニル基又は C_3-

C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

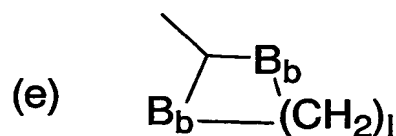


(c) -基 ((c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



10

(d) -基 (1は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) -基 (1及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、

$M_c R_e N-CO-NR_e'$ 一基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c R_e N-C(=NR_e')-NR_e''$ 一基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ 一基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_c R_e N-SO_2$ 一基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_1 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ 一基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ 一基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 一基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10 アルキレン基を表す。) である。

IV. Q_A は、水酸基、(b) 一基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ 一基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)-$ 一基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ 一基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ 一基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N-SO_2-B_c$ 一基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ 一基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ 一基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ 一基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10 アルキレン基を表し、

B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

- 5 ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_1-R_4 -基 { D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 、 (b) - R_4 -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 (c) - R_4 -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_2-R_4 -基 { D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 、 D_3-R_4 -基 { D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 { A_4 は、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。) 、 (c) -基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

- 15 (2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

- (3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。) 、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 、 (b) - R_4' -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 、 (c) - R_4' -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、

す。)、 D_3-R_4' -基(D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基(R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。))を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。}を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。))を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)

又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(iii) D_1 群: ($R_1-(O)_k-A_1N-(O)_{k'}$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は1を表す。) である。

5 (iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS -基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

10 (vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲ

15 ン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b)-R_4$ -基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4$ -基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。

20)、 D_4-R_4 -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-

25 C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ -基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ -基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

5 3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) -基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c) -基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

10 である。]

V. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

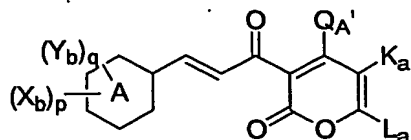
15 但し、 K_a が水素原子で L_a がメチル基でA環がベンゼン環のとき、 q が0の場合には p は2、3又は4である。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

5. 式 (V)

(V)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_b)_p$ において、 X_b は、炭素原子上の置換基であって、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C10アルコキシ基、又は、R_B-基（Rは、C1-C10ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_b は同一又は相異なる。

III. $(Y_b)_q$ において、 Y_b は、炭素原子上の置換基であって、下記のX₂群又はY₂群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_b は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_b は、Z₂群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X₂群：

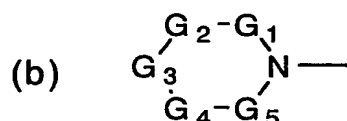
M_a-基 [M_aは、R_b-基（R_bは、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。）、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、R_c-B_a-R_d-基（R_cは、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、B_aは、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、R_dは、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。）、HOR_d-基（R_dは、前記と同一の意味を表す。）、R_e-CO-R_d-基（R_eは、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、R_dは、前記と同一の意味を表す。）、R_e-CO-O-R_d-基（R_e及びR_dは、前記と同一の意味を表す。）、R_eO-CO-R_d-基（R_e及びR_dは、前記と同一の意味を表す。）、HO-CO-CH=CH-基、R_eR_e'N-R_d-基（R_e及びR_e'は、同一又は相異なり、R_eは、前記と同一の意

味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一
 5 の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。] である。

但し、 A がベンゼン環を表すとき、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくは C_1-C_{10} アルコキシ基で置換されてもよい C_1-C_{10} アルキル基、又は、ニトロ基、又は、 C_1-C_{10} アルコキシ基、又は、 RB -基 (R 及び B は、前記と同一の意味を表す。) を除く。

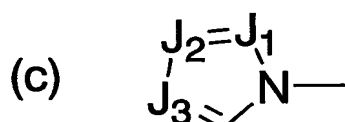
(2) Y_2 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は

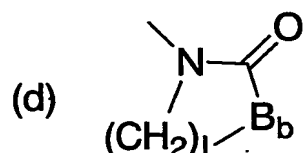


(b)-基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重

結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1- 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

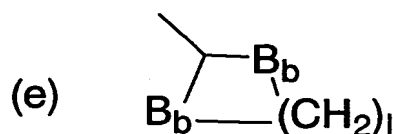


- 10 (c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。))、



(d) -基 (1 は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)

又は



(e) -基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a- 基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO- 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-O-$ 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO- 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN- 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e-$ 基 (M_c 及び R_e は、前記と同

一の意味を表す。) 、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_2 群:

10 $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。) 、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されて

15 もよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。) である。

III. Q_A' は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。) 、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。] 、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。) 、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、(b)- SO_2-B_c -基 ((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8'

25

群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4'

は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基(D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

5 (4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基(R_4 は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ -基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。))を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。]を表す。] である。

25 (ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$

) -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

5 (iii) D_1 群: ($R_1-(O)_k-A_1N-(O)_k$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS -基である。

10 (v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - R_4 -基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 -基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (R_1 及び m は、前記と同一

の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ 一基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチ

5 オ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2 - R_4 - B_4$ 一基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ 一基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)一基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

10 5) (c)一基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ 一基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)である。]

IV. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b 一基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し

15 、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0の場合には p は2、3又は4である。

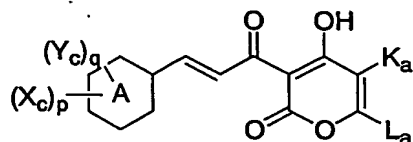
尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲

20 内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物；

6. 式 (VI)

(VI)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_c)_p$ において、 X_c は、炭素原子上の置換基であって、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、 $R' - S(O)_1$ 基（ R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。）、又は、シアノ基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基、又は、アミノカルボニル基、又は、 $(R')_2N$ -基（ R' は、前記と同一の意味を表す。）、又は、 $R'CO-NH$ -基（ R' は、前記と同一の意味を表す。）、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基、又は、 RB -基（ R は、C1-C10ハロアルキル基を表し、 B は、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_c は同一又は相異なる。

III. $(Y_c)_q$ において、 Y_c は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_3 群又は Y_3 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_c は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_c は、 Z_3 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X_3 群：

M_a -基 [M_a は、 R_b -基（ R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。）、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c - B_a - R_d$ -基（ R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。）、 HOR_d -基（ R_d は、前記と同一の意味を表す。）

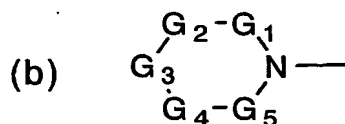
、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、 $R'-S(O)_1$ -基 (R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。)、又は、シアノ基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基、又は、アミノカルボニル基、又は、 $(R')_2N$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R'CO-NH$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基を除く。

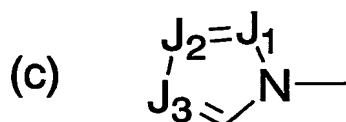
(2) Y_3 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基

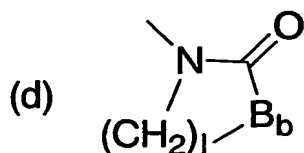
(M_aは、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいピリジル基、又は、M_a-基 (M_aは、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいナフチル基、又は



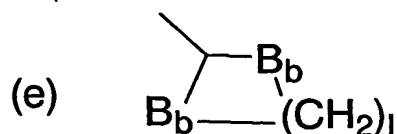
(b) -基 { (b) において、G₁、G₂、G₄及びG₅は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、G₃は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは-NR₁-基 {R₁は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基 (R₂は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、B₁は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは-NR₁-基 (R₁は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、



(c) -基 ((c) において、J₁、J₂及びJ₃は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、



(d) -基 (1は、2、3又は4であり、B_bは、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



- (e) ー基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a ー基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、
 10 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ ー基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ ー基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。
 15 但し、 p が 0 のとき、モルホリノ基、又は、フェニル基、又は、トリフルオロメチル基で置換されたフェノキシ基、又は、単数又は複数のハロゲン原子で置換されたフェノキシ基を除く。

(3) Z_3 群:

- ー $N=C(Y_a)-Y_a'$ ー基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
 20)、ー $Y_b-Y_b'-Y_b''$ ー基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されて
 25 もよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表

す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

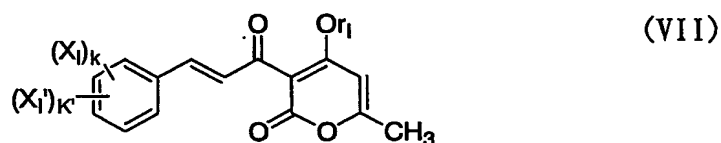
但し、 p が0のとき、 Y_c は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキサソール環をなすことはない。

- 5 I V. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基(M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはなく、A環がベンゼン環又はピリジン環のいずれの場合も、 p と q は同時に0となることはない。

- 10 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]で示される2H-ピラン-2-オン化合物；

15 7. 式 (VII)

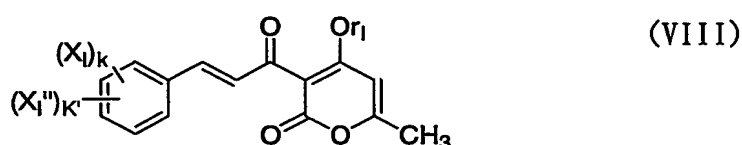


- [式中、 X_1 はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、 $R_1-S(O)_1$ -基(R_1 はC1-C4アルキル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、シアノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_1)_2N$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1O-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1NH-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。))又は (R_1') ₂N-CO-基(R_1' は水素原子又
- 20

はC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_I' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 RB -基 (B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 k は0又は1を表し、 k' は0～4の整数を表し、 k が0の場合には k' は2～4の整数であり、 k' が2～4の場合には X_I' は相異なってよく、 r_I はC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基である。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

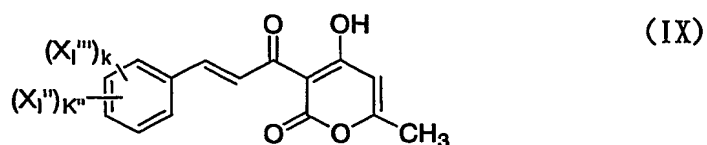
8. 式 (VIII)



[式中、 X_I はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、 $R_I-S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、 1 は0～2の整数を表す。)、シアノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_I)_2N$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $R_IO-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-NH-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)又は $(R_I')_2N-CO$ -基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_I'' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 RB -基 (B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 k は0又は1を表し、 k' は0～4の整数を表し、 k が0の場合には k' は2～4の整数であり、 k' が2～4の場合には X_I'' は相異なってよく、 r_I はC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基である。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物；

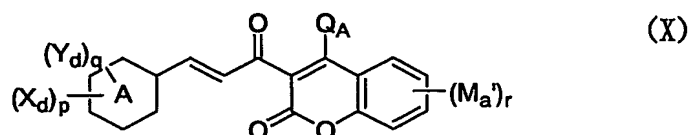
9. 式 (IX)



[式中、 X_I''' はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、カルボキシ基、C2-C4アルコキシカルボニル基又は $(R_{I I})_2 N$ -基 ($R_{I I}$ はC2-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_I'' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 RB -基 (B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 k は0又は1を表し、 k'' は0～2の整数を表し、 k が0の場合には k'' は2であり、 k'' が2の場合には X_I'' は相異なる。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物；

10. 式 (X)



[式中、

I. A は、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_d)_p$ において、 X_d は、炭素原子上の置換基であって、メトキシ基又はエトキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。

III. $(Y_d)_q$ において、 Y_d は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_4 群又は Y_4 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上の

とき、 Y_d は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_d は、 Z_4 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_4 群:

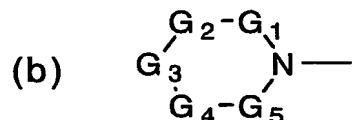
M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

ただし、Aがベンゼン環を表すとき、メトキシ基及びエトキシ基を除く。

(2) Y_4 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は、

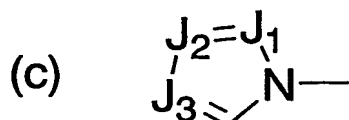
5 、



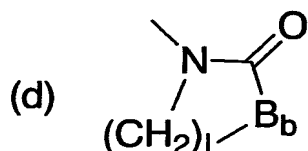
(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは

10 は $-NR_1$ -基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、

15 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。} 、



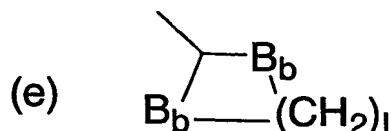
(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、



20

(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)

又は



(e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_4 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表す。)
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10 アルキレン基を表す。) である。

- IV. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9 - B_6 - B_c -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基 (m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、
- 5 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 A_7'' - SO_2 - B_c -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 A_8 - SO_2 - B_c -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N$ - SO_2 - B_c -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意
- 10 味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - SO_2 - B_c -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9' - B_c -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 - B_c -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c - B_3 - B_c -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c - B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

- ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 R_2 - B_1 - R_4 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - R_4 -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 A_4 - SO_2 - R_4 -基 (A_4 は、(b) -

基（（b）は、前記と同一の意味を表す。））、（c）-基（（c）は、前記と同一の意味を表す。）又は R_1R_1' -N-基（ R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。）又は A_2-CO-R_4 -基（ A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。）である。

5 （2） A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

（3） A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基（ R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。））、 D_4-R_4' -基（ D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_1-R_4' -基（ D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、（b）- R_4' -基（（b）及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、（c）- R_4' -基（（c）及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_2-R_4 -基（ D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。））、 D_3-R_4' -基（ D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））又は A_2-CO-R_4 -基（ A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。））である。

（4） A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

（5） A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基（ R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_4-R_4' -基（ D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_5-R_4 -基（ D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。））、 D_1-R_4' -基（ D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、（b）- R_4' -基（（b）及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、（c）- R_4' -基（（c）及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_2-R_4 -基（ D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。））、 NO_2-R_4 -基（ R_4 は、前記と同一の意味を表す。））又は A_2-CO-R_4 -基（ A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。））である。

（i） D_4 群：水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基（ R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基（ R_2 及び B_1

は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。)を表す。]である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基(R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-)$ $A_1 N-(O)_k$ -基(R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基(R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基(A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は NH_2-CS -基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 -基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基(R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されても

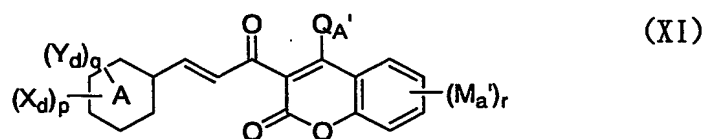
- よい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - R_4 - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_2 - B_1 - R_4 - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - R_4 - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - R_4 - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - R_4 - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは A_4 - SO_2 - R_4 - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-
 10 C10アルキル基を表し、
 B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]
 、
 2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を
 15 表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチ
 オ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B_4
 B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、
 3) $R_2 - SO_2 - NR_1 -$ 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し
 、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、
 20 4) (b) - 基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、
 5) (c) - 基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は
 6) $R_1 A_1 N - NR_1' -$ 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。
 V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2
 25 、3又は4を表す。
 但し、A環がベンゼン環のとき、 q 及び r が0の場合には p は2、3又は4である。
 。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、

当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

- 5 で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

1 1. 式 (XI)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

- 10 I I. $(X_d)_p$ において、 X_d は、炭素原子上の置換基であって、メトキシ基又はエトキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。

- I I I. $(Y_d)_q$ において、 Y_d は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_4 群又は Y_4 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上の
15 とき、 Y_d は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_d は、 Z_4 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_4 群：

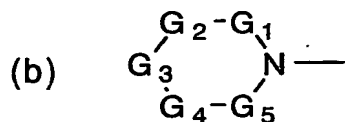
- M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -
20 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよ

- いC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O
 $-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基
 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 R
 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意
 5 味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表
 す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の
 意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一
 の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e''
 10 $''$ は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''
 は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-$
 $C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''
 は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e
 $'''$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b-
 15 $SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e
 $R_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

ただし、Aがベンゼン環を表すとき、メトキシ基及びエトキシ基を除く。

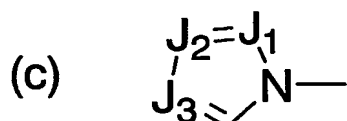
(2) Y_4 群:

- 20 M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a
 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基
 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a
 -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいナフチル基、又は

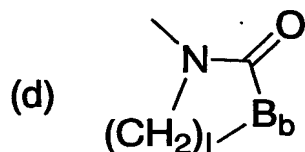


- 25 (b)-基 { (b)において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ば
 れた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ば

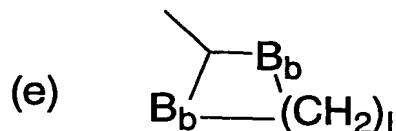
れた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基（ R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1- 基（ R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。）で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。）で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基（ R_1 は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。）



(c) -基（(c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。）



(d) -基（ l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。）又は



(e) -基（ l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。）を表す。） M_c-B_a- 基（ M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。） M_c-CO- 基（ M_c は、前記と同一の意

味を表す。)、 M_c-CO-O -基(M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基(M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)又は $M_cR_eN-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_4 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。) である。

IV. Q_A' は、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基(m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基(A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基(R_1 は

前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b) - SO_2 - B_c$ -基((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9' - B_c$ -基(A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - B_c$ -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - B_3 - B_c$ -基(B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。))又は $M_c - B_c$ -基(M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

- 10 ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ -基(D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ -基(D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b) - R_4$ -基((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4$ -基((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ -基(D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ -基(D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4 - SO_2 - R_4$ -基(A_4 は、 (b) -基((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 (c) -基((c) は、前記と同一の意味を表す。))又は $R_1 R_1' N$ -基(R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は $A_2 - CO - R_4$ -基(A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

- 25 (2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ -基(R_2 及び B_1 は

、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4' 基 (D_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' 基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4' 基 (A_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4' 基 (D_5 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4' 基 (D_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4' 基 (R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4' 基 (A_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O- 基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ 基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ 基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。)) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0 又は 1 を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は 0 となりかつ R_3 が水素原子となることはない。) を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)-$ 基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

- $A_1 - (O)_n - N = C(R_3) -$ 基 (A_1 , n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。
)、 $R_1 - B_0 - CO - R_4 - (O)_n - N = C(R_3) -$ 基 [R_1 , R_4 , n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$
) - 基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2 - R_4 - (O)_n - N = C(R_3) -$ 基 (D_2 , R_4 , n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
- 5 又は $R_1 A_1 N - N = C(R_3) -$ 基 (R_1 , A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- (iii) D_1 群: ($R_1 - (O)_k -$) $A_1 N - (O)_k -$ 基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。
- 10 (iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N - (O)_n - A_1) -$ 基 (R_1 , R_1' , n , 及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C(-OR_2) -$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $NH_2 - CS -$ 基である。
- (v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 OSO_2 -$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 15 (vi) A_2 群:
- 1) $A_3 - B_4 -$ 基
- [A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m -$ 基 (R_a は、ハロゲン
- 20 ン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - $R_4 -$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - $R_4 -$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4 -$ 基 (R_2 , B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。
- 25)、 $D_4 - R_4 -$ 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$ 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4 -$ 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4 -$ 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4 -$ 基 (A_4 は、

前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)-$ 基(R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

5 、

2) $R_1-B_4-CO-R_4-B_4'-$ 基(R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2-R_4-B_4-$ 基(D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

10 3) $R_2-SO_2-NR_1-$ 基(R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c)-基((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1 A_1 N-NR_1'-$ 基(R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

15 である。

V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

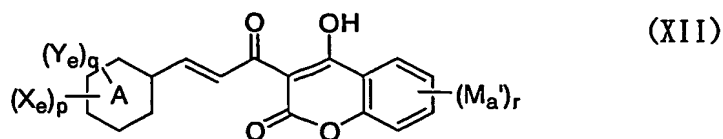
但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0の場合には p は2、3又は4である。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、

20 当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物；

25 12. 式 (XII)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_e)_p$ において、 X_e は、水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、 $R'-S(O)_1$ -基 (R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。)、シアノ基、 $HOCO-CH=CH$ -基、 $(R')_2N$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、 $R'-CO-NH$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、ニトロ基又はC1-C10アルコキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。

III. $(Y_e)_q$ において、 Y_e は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_5 群又は Y_5 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_e は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_e は、 Z_5 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_5 群：

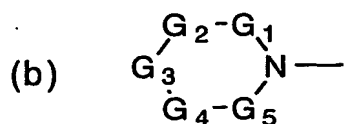
M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR'_eN-R_d$ -基 (R_e 及び R'_e は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意

味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一
 5 の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
 10 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_e -基 (X_e は、前記と同一の意味を表す。) を除く。
 15

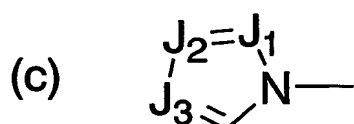
(2) Y_5 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいナフチル基、又は
 20



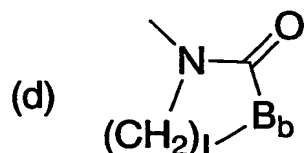
(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重
 25 結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子

若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、
 5 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、



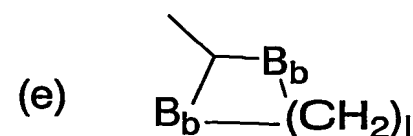
(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、

10



(d) -基 (1は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は

15



(e) -基 (1及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同
 20

一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 5 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_5 群:

10 $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)
 15 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

但し、 p が0のとき、 Y_e は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキサール環をなすことはない。

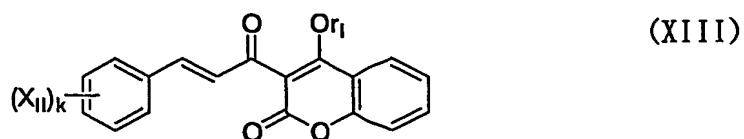
20 I V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該
 25 複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物;

13. 式 (XIII)

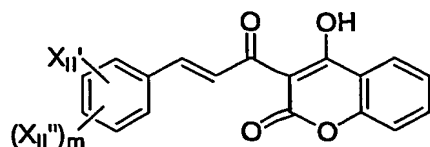


[式中、 X_{11} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C3-C4アルコキシ基、又は、 $R_1-S(O)_1$ -基（ R_1 はC1-C4アルキル基を表し、1は0～2の整数を表す。）、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_1)_2N$ -基（ R_1 は前記と同一の意味を表す。）、又は、 $R_1-CO-NH$ -基（ R_1 は前記と同一の意味を表す。）、又は、 $R_1O-CO-NH$ -基（ R_1 は前記と同一の意味を表す。）、又は、 $R_1NH-CO-NH$ -基（ R_1 は前記と同一の意味を表す。）、又は、 $(R_1')_2N-CO$ -基（ R_1' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。）、又は、 RB -基（ B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。）を表し、 k は1～4の整数を表し、 k が2～4の整数の場合には X_{11} は相異なってよく、 r_1 は、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基を表す。

]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物；

14. 式 (XIV)

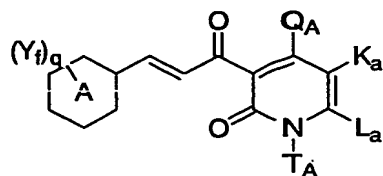


(XIV)

- [式中、 X_{II}' はハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されたC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C3-C4アルコキシ基、 $R_{II}-S(O)_1$ -基 (R_{II} はC2-C4アルキル基を表し、1は0～2の整数を表す。)、シアノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_{II})_2N$ -基 (R_{II} は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-CO-NH$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表す。)、 $R_I-O-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-NH-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $(R_I')_2N-CO$ -基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)又は RB -基(Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)]
- 10)を表し、 X_{II}' は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基又はC3-C4アルコキシ基を表し、mは1又は2を表し、mが2の場合には X_{II}' は相異なってよい。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物；

15. 式 (XV)



(XV)

[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_f)_q$ において、 Y_f は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又はY群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、

- 5 Y_f は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_f は、Z群の基をなしてA環と縮環してもよい。

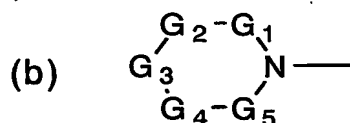
(1) X群：

- M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -
- 10 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
- R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O
- 15 $-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 20 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e

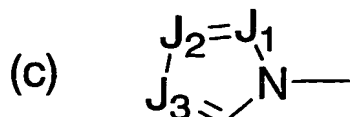
$R_e' - N - SO_2 - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

(2) Y群:

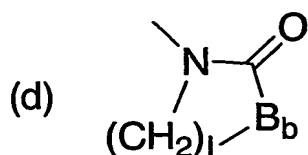
- $M_b - R_d$ - 基 [M_b は、 M_c - 基 { M_c は、 $M_d - R_d'$ - 基 { M_d は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は、



- (b) - 基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、



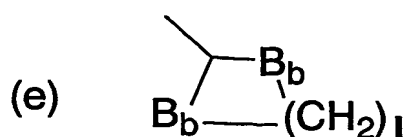
(c) - 基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) ー基 (1 は、2、3 又は 4 であり、B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)

又は

5



(e) ー基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、R_d' は、R_d と同一又は相異なり、R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、M_c-B_a-基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、M_c-CO-基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、M_c-CO-O-基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、M_cO-
10 CO-基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、M_cR_eN-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_c-CO-NR_e-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_cO-CO-NR_e-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_cR_eN-CO-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、
15 M_cR_eN-CO-NR_e'-基 (M_c、R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e'-基 (M_c、R_e、R_e' 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、M_c-SO₂-NR_e-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
又は M_cR_eN-SO₂-基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z 群:

20 (3) Z 群: -N=C(Y_a)-Y_a'-基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、-Y_b-Y_b'-Y_b''-基 (Y_b 及び Y_b' は、同一又は相異

なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。) である。

I I I. Q_A は、水酸基、(b) -基((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基(m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基(A_7'' は、下記の A_7 "群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - SO_2-B_c -基((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基(A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基(B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基(M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基(D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基(D

$_1$ は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、(b)
 $-R_4$ -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。
)、(c) $-R_4$ -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一
 の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 { D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、
 5 前記と同一の意味を表す。}、 D_3-R_4 -基 { D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し
 、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 { A_4 は、(b) $-$
 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-$ 基 ((c) は、前記と同一
 の意味を表す。) 又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す
 。)を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は
 10 、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基
 である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原
 子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は
 15 、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4'
 $'$ -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及
 び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4'
 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記
 と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表
 20 す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2
 $-CO-R_4$ -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケ
 ニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$
 25 $-$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4
 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記
 と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味
 を表す。)、(b) $-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。

）、（c）-R₄'-基（（c）及びR₄'は、前記と同一の意味を表す。）、D₂-R₄-基（D₂及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）、NO₂-R₄-基（R₄は、前記と同一の意味を表す。）又はA₂-CO-R₄-基（A₂及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）である。

- 5 (i) D₄群：水酸基又はA₁-O-基 [A₁は、R₃-(CHR₀)_m-(B₂-B₃)_{m'}-基 {R₃は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基（R₂及びB₁は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、R₀は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、mは、前記と同一の意味を表し、B₂は、
10 単結合、オキシ基、チオ基又は-N((O)_nR₁')-基（R₁'は、前記と同一の意味を表し、nは、0又は1を表す。）を表し、B₃は、前記と同一の意味を表し、m'は、0又は1を表し、B₃がスルホニル基のとき、mは0となりかつR₃が水素原子となることはない。}を表す。] である。

(ii) D₅群：O=C(R₃)-基（R₃は、前記と同一の意味を表す。）、

- 15 A₁-(O)_n-N=C(R₃)-基（A₁、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）、R₁-B₀-CO-R₄-(O)_n-N=C(R₃)-基 [R₁、R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表し、B₀は、オキシ基、チオ基又は-N((O)_mR₁')-基（R₁'及びmは、前記と同一の意味を表す。）を表す。]、D₂-R₄-(O)_n-N=C(R₃)-基（D₂、R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）
20 又はR₁A₁N-N=C(R₃)-基（R₁、A₁及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）である。

(iii) D₁群：(R₁-(O)_k-)A₁N-(O)_{k'}-基（R₁及びA₁は、前記と同一の意味を表し、k及びk'は、同一又は相異なり、0又は1を表す。）である。

- (iv) D₂群：シアノ基、R₁R₁'NC(=N-(O)_n-A₁)-基（R₁、R₁'、
25 n、及びA₁は、前記と同一の意味を表す。）、A₁N=C(-OR₂)-基（A₁及びR₂は、前記と同一の意味を表す。）又はNH₂-CS-基である。

(v) D₃群：ニトロ基又はR₁OSO₂-基（R₁は、前記と同一の意味を表す。）である。

(vi) A_2 群:

1) $A_3 - B_4$ - 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - R_4 - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

である。

I V. T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

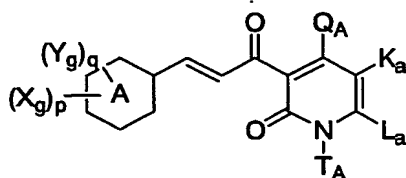
- 5 V. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10 アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 K_a と L_a とは C1-C10 アルキレン基をなすことがある。

- 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該
10 複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される 2(1H)-ピリジノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする I 型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

- 15 16. 式 (XVI)

(XVI)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

- I I. $(X_g)_p$ において、 X_g は、水酸基、ハロゲン原子、 (R') ₂N-基 (R' は、C1-C10 アルキル基を表す。)、ニトロ基又は C1-C10 アルコキシ基を表し、
20 p は 0、1、2、3 又は 4 を表し、 p が 2 以上のとき、 X_g は同一又は相異なる。

I I I. $(Y_g)_q$ において、 Y_g は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_6

群又は Y_g 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_g は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_g は、 Z_g 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_g 群：

- 5 M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 10 、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 15)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e''''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 25 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

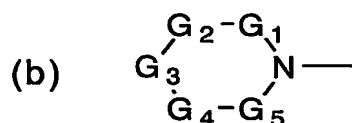
但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_g -基 (X_g は、前記と同一の意味を表す。

)を除く。

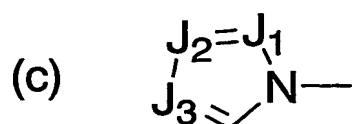
(2) Y_6 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基

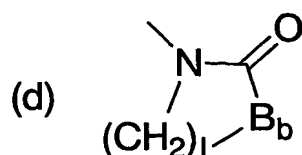
5 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は



(b)-基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

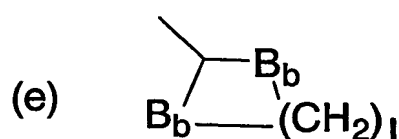


20 (c)-基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (1 は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は

5



(e) -基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-O - CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_b 群:

20 - $N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレ

ン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。) である。

- I V. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)-$ 基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'-N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

- ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D

1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、(b) $-R_4$ -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-R_4$ -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 { D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。 }、 D_3-R_4 -基 { D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。 }、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 { A_4 は、(b) $-$ 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-$ 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。 } 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) A₈ 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' ー基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A₈' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ 一基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' 一基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 一基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 一基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ 一基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)

）、（c）-R₄'-基（（c）及びR₄'は、前記と同一の意味を表す。）、D₂-R₄-基（D₂及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）、NO₂-R₄-基（R₄は、前記と同一の意味を表す。）又はA₂-CO-R₄-基（A₂及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）である。

- 5 (i) D₄群：水酸基又はA₁-O-基〔A₁は、R₃-(CHR₀)_m-(B₂-B₃)_m-基〔R₃は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基（R₂及びB₁は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、R₀は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、mは、前記と同一の意味を表し、B₂は、
10 単結合、オキシ基、チオ基又は-N（（O）_nR₁'）-基（R₁'は、前記と同一の意味を表し、nは、0又は1を表す。）を表し、B₃は、前記と同一の意味を表し、m'は、0又は1を表し、B₃がスルホニル基のとき、mは0となりかつR₃が水素原子となることはない。〕を表す。〕である。

(ii) D₅群：O=C（R₃）-基（R₃は、前記と同一の意味を表す。）、

- 15 A₁-(O)_n-N=C（R₃）-基（A₁、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）、R₁-B₀-CO-R₄-(O)_n-N=C（R₃）-基〔R₁、R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表し、B₀は、オキシ基、チオ基又は-N（（O）_mR₁'）-基（R₁'及びmは、前記と同一の意味を表す。）を表す。〕、D₂-R₄-(O)_n-N=C（R₃）-基（D₂、R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）
20 又はR₁A₁N-N=C（R₃）-基（R₁、A₁及びR₃は、前記と同一の意味を表す。）である。

(iii) D₁群：（R₁-(O)_k-）A₁N-(O)_{k'}-基（R₁及びA₁は、前記と同一の意味を表し、k及びk'は、同一又は相異なり、0又は1を表す。）である。

- (iv) D₂群：シアノ基、R₁R₁'NC（=N-(O)_n-A₁）-基（R₁、R₁'、
25 n、及びA₁は、前記と同一の意味を表す。）、A₁N=C（-OR₂）-基（A₁及びR₂は、前記と同一の意味を表す。）又はNH₂-CS-基である。

(v) D₃群：ニトロ基又はR₁OSO₂-基（R₁は、前記と同一の意味を表す。）である。

(vi) A_2 群:

1) $A_3 - B_4$ - 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m$ - 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b) - R_4$ - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4$ - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)] 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1 -$ 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) $(b) -$ 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) $(c) -$ 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1' -$ 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

である。

V. T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -
 R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -基 (M_c は、前記
 と同一の意味を表す。) を表す。

- 5 VI. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素
 原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し
 、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

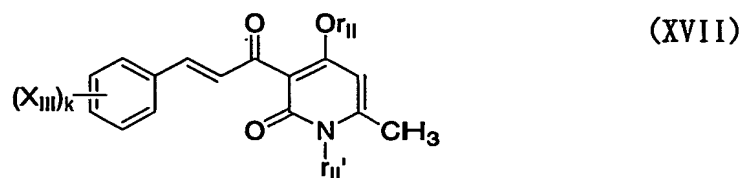
但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0 となることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、

- 10 当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該
 複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲
 内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいこと
 を意味するものである。]

で示される2(1H)-ピリジノン化合物；

- 15 17. 式 (XVII)

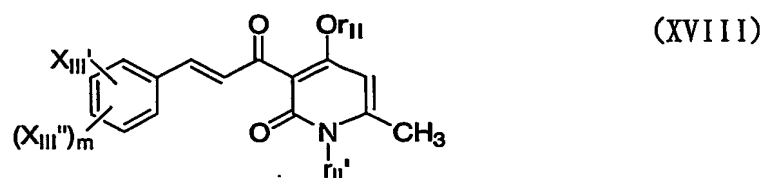


[式中、 X_{III} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原
 子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4ア
 ルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 R_I -
 $S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、1 は0 ~ 2 の整数を表す。) 、又
 20 は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカル
 ボニル基、又は、 $(R_I)_2 N$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。) 、又は、
 $R_I - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。) 、又は、 $R_I O - CO$

-NH-基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 R_I NH-CO-NH-
 基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 (R_I') ₂ N-CO-基 (R_I
 ' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、RB-基 (Bは酸素原子又
 は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表
 5 し、kは1~4の整数を表し、kが2~4の整数の場合には X_{III} は相異なってよ
 く、 r_{III} 及び r_{III}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表
 す。]

で示される2(1H)-ピリジノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI
 型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

10 18. 式 (XVIII)



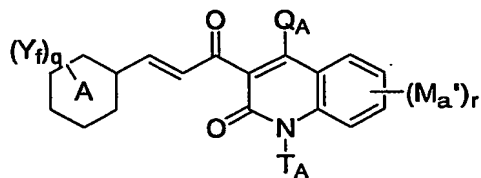
[式中、 X_{III}' はC2-C4アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ
 基で置換されたC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニ
 ル基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 R_I -S(O)₁-基 (R_I はC1-C4アルキ
 ル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基
 15 、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、 (R_{III}) ₂ N-基 (R_{III} はC2-C4アル
 キル基を表す。)、又は、 R_I -CO-NH-基 (R_I は前記と同一の意味を表す
 。)、又は、 R_I O-CO-NH-基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は
 、 R_I NH-CO-NH-基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(R_I$
 ')₂ N-CO-基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、R
 20 B-基 (Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4ア
 ルキル基を表す。)を表し、 X_{III}'' は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル
 基、又は、C1-C4アルコキシ基を表し、mは1又は2を表し、mが2の場合には X_I

$r_{I I'}$ は相異なってよく、 $r_{I I}$ 及び $r_{I I'}$ は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。]

で示される2(1H)-ピリジノン化合物；

19. 式 (XIX)

(XIX)



5 [式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_f)_q$ において、 Y_f は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又はY群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_f は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_f は、Z群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X群：

M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基

(R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意

味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。

)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の

意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

5 の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e''

' ' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''

は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-$

$C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e''''

は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''''

10 ' ' ' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b-

$SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e

$R_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

(2) Y群:

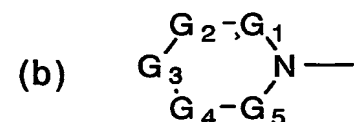
15 M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a

は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基

(M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a

-基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、又は

、



20 (b)-基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ば

れた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ば

れた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重

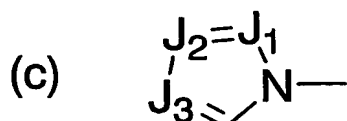
結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しく

は $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子

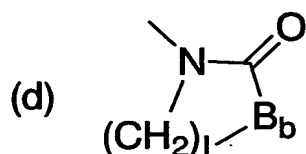
25 若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-

C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニ

ル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

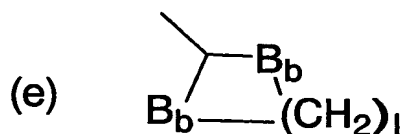


(c) -基 ((c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



10

(d) -基 (1は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) -基 (1及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、

$M_c R_e N-CO-NR_e'$ 一基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c R_e N-C(=NR_e')-NR_e''$ 一基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ 一基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_c R_e N-SO_2$ 一基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ 一基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
 10)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ 一基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 一基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-
 15 C10 アルキレン基を表す。) である。

III. Q_A は、水酸基、(b) 一基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ 一基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ 一基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ 一基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ 一基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N-SO_2-B_c$ 一基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一
 20 の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ 一基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ 一基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ 一基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10 アルキレン基を表

し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

5 (1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記

と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基(D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

- 5 (5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基(R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。
- 10

- 15 (i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ -基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。 } を表す。] である。
- 20

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

- 25 $A_1-(O)_n-N\equiv C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N\equiv C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]、 D_2-R_4- (

O)_n-N=C(R₃)-基(D₂R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。)
又はR₁A₁N-N=C(R₃)-基(R₁、A₁及びR₃は、前記と同一の意味を
表す。)である。

(iii)D₁群:(R₁-(O)_k)-A₁N-(O)_{k'}-基(R₁及びA₁は、前記と同
5 一の意味を表し、k及びk'は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

(iv)D₂群:シアノ基、R₁R_{1'}NC(=N-(O)_n-A₁)-基(R₁、R_{1'}、
n、及びA₁は、前記と同一の意味を表す。)、A₁N=C(-OR₂)-基(A₁及
びR₂は、前記と同一の意味を表す。)又はNH₂-CS-基である。

(v)D₃群:ニトロ基又はR₁OSO₂-基(R₁は、前記と同一の意味を表す。)で
10 ある。

(vi)A₂群:

1)A₃-B₄-基

[A₃は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又
は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で
15 置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、R_a-(R₄)_m-基(R_aは、ハロゲ
ン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されても
よい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、R₄及びm
は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b)-R₄-基((b)及びR₄は、前記
と同一の意味を表す。)、(c)-R₄-基((c)及びR₄は、前記と同一の意味
20 を表す。)、R₂-B₁-R₄-基(R₂、B₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。
)、D₄-R₄-基(D₄及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₅-基(D₅は
、前記と同一の意味を表す。)、D₁-R₄-基(D₁及びR₄は、前記と同一の意味
を表す。)、D₂-基(D₂は、前記と同一の意味を表す。)、D₃-R₄-基(D₃
及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)若しくはA₄-SO₂-R₄-基{A₄は、
25 前記と同一の意味を表し、R₄は、前記と同一の意味を表す。}で置換されたC1-
C10アルキル基を表し、

B₄は、オキシ基、チオ基又は-N((O)_mR₁)-基(R₁及びmは、前記と同一
の意味を表す。)を表す。但し、B₄がチオ基のとき、A₃が水素原子ではない。]

、

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。

IV. T_A は、水素原子、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

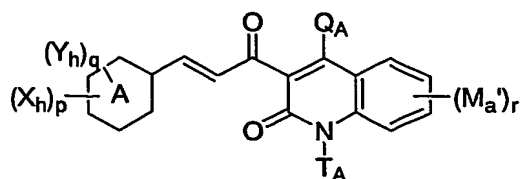
V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は 0、1、2、3 又は 4 を表す。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される 2(1H)-キノリノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする I 型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

20. 式 (XX)

(XX)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_h)_p$ において、 X_h は、水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシカルボニル基、 $(R')_2N$ -基 (R' は、C1-C10アルキル基を表す。)、ニトロ基又はC1-C10アルコキシ基を表し、pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_h は同一又は相異なる。但し、pが2以上のとき、 X_h が水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基及びC1-C10アルコキシ基から選ばれる場合、 X_h は同時に同一の基又は原子を表すことはない。

III. $(Y_h)_q$ において、 Y_h は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_7 群又は Y_7 群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_h は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_h は、 Z_7 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_7 群：

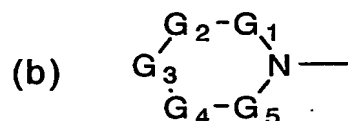
M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基

(R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH-$ 基、 $R_e R_e' N-R_d-$ 基(R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d-$ 基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b O-CO-N(R_e)-R_d-$ 基(R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-R_d-$ 基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d-$ 基(R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d-$ 基(R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d-$ 基(R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-SO_2-R_d-$ 基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、
 15 C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_h- 基(X_h は、前記と同一の意味を表す。)を除く。

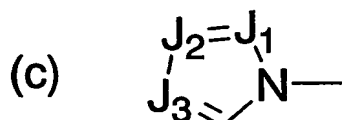
(2) Y_7 群:

M_b-R_d- 基 [M_b は、 M_c- 基 (M_c は、 $M_d-R_d'-$ 基 (M_d は、 M_a- 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a- 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a- 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいナフチル基、又は、
 20

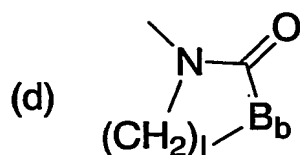


(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重
 25

結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは
 は $-NR_1-$ 基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子
 若しくは R_2-B_1- 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-
 C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニ
 5 ル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は
 、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、
 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$
 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン
 基を表す。}、

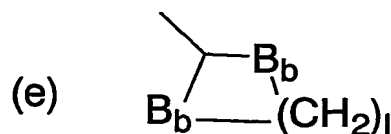


10 (c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基
 で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)

15 又は



(e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と
 同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a- 基 (M_c 及
 び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO- 基 (M_c は、前記と同一の意
 20 味を表す。)、 $M_c-CO-O-$ 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-
 $CO-$ 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN- 基 (M_c 及び R_e は

、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)
 5)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_7 群:

10 $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アル
 15 キル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)
 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

但し、 p が0のとき、 Y_h は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキソール環をなすこと
 20 とはない。

IV. Q_A は、水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基[A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基(m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。但し、
 25 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基(A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N$

- $-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 10 (1) A_7 群:
 ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-R_4$ -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-R_4$ -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b) $-$ 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-$ 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 25 (2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。
 (3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原

子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' ー基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

- 10 (5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 ー基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 ー基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

- 20 (i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O ー基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ ー基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、
25 単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ ー基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0 又は 1 を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は 0 となりかつ R_3 が水素原子となることはない。) を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ - 基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ - 基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。
 。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ - 基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$
 5) - 基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ - 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1N-(O)_k)$ - 基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ - 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS - 基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 - 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ - 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b)-R_4$ - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4$ - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 - 基 (D_3

及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)-$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1-B_4-CO-R_4-B_4'$ -基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2-R_4-B_4$ -基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。

V. T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

VI. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

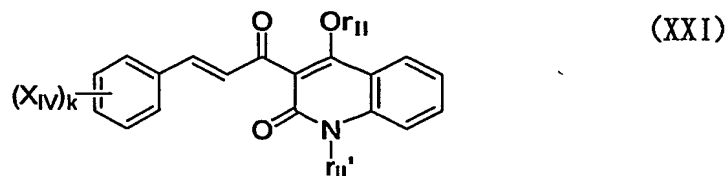
但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはなく、A環がベンゼン環又はピリジン環のいずれの場合も、 p と q は同時に0となることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいこと

を意味するものである。]

で示される2(1H)-ピリジノン化合物；

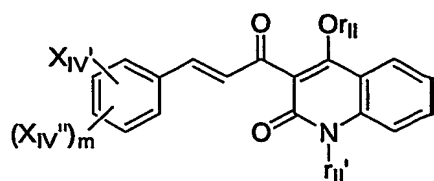
21. 式 (XXI)



- [式中、 X_{IV} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 $R_I-S(O)_1$ -基(R_I はC1-C4アルキル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_I)_2N$ -基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-CO-NH$ -基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-O-CO-NH$ -基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-NH-CO-NH$ -基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(R_I')_2N-CO$ -基(R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、 RB -基(B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)]を表し、 k は1~4の整数を表し、 k が2~4の整数の場合には X_{IV} は相異なってよく、 r_{II} 及び r_{II}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。]

で示される2(1H)-キノリノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物；

22. 式 (XXII)



(XXII)

[式中、 X_{IV}' はC2-C4アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されたC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 $R_I - S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C2-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_{II})_2N$ -基 (R_{II} はC2-C4アルキル基を表す。)、又は、 $R_I - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I O - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I NH - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 (R_I') ₂N-CO-基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、 RB -基 (Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_{IV}' は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基又はC1-C4アルコキシ基を表し、mは1又は2を表し、mが2の場合には X_{IV}' は相異なってよく、 r_{II} 及び r_{II}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。]

15 で示される2(1H)-キノリノン化合物；

23. I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用；

24. I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用；

25. 前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22

記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする組織線維化改善組成物；

26. 有効量の前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法；

5 27. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用；

28. 前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするTGF- β 作用抑制組成物；

10 29. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用；

30. 前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする養毛組成物；

15 31. 有効量の前項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物を、養毛処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法；

32. I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として
20 含有される化合物の使用；

33. I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用；

25 34. 前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする組織線維化改善組成物；

35. 有効量の前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の

組成物に有効成分として含有される化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法；

36. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される

5 化合物の使用；

37. 前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするTGF- β 作用抑制組成物；

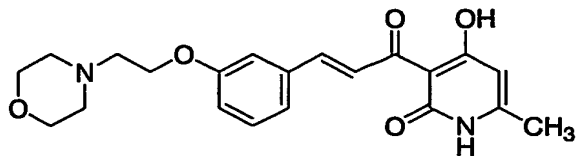
38. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用；

39. 前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする養毛組成物；

40. 有効量の前項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物を、養毛処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法；

41. 式 (XXIII)

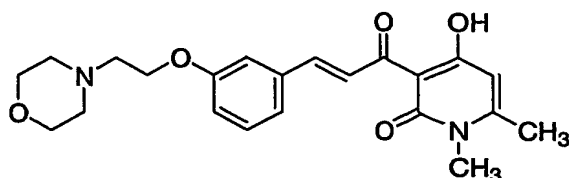
(XIII)



20 で示される2(1H)-ピリジノン化合物；

42. 式 (XXIV)

(XIV)



で示される2(1H)-ピリジノン化合物；
等を提供するものである。

発明を実施するための最良の形態

5 以下、本発明を詳細に説明する。

本発明において、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基及びアルキレン基における飽和炭化水素基は、分枝していてもよく、またその炭素原子の一部又は全部で環を形成してもよく、アルケニル基、アルケニルオキシ基、アルキニル基、アルキニルオキシ基及びアルケニレン基における不飽和炭化水素基は、分枝をもっていてよく、またその炭素原子の一部又は全部で環を形成してもよく、その不飽和結合数は単数又は複数である。

本発明において、アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロヘキシル基、シクロプロピルメチル基等があげられ、ハロアルキル基としては、例えば、2, 2, 2-トリフルオロエチル基等があげられ、アルコキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、シクロペンチルオキシ基、2-シクロヘキシルエトキシ等があげられ、アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ基等があげられ、アルキルスルフィニル基としては、例えば、メチルスルフィニル基等があげられ、アルキルスルホニル基としては、例えば、メチルスルホニル基等があげられ、アルキレン基としては、例えば、メチレン基、エチルエチレン基、1, 4-シクロヘキシレン基等があげられ、アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、1, 3-ブタジエニル基、3-シクロヘキセニル基等があげられ、アルキニル基としては、例えば、エチ

ニル基、2-プロピニル基、2-ペンテン-4-イニル基等があげられ、アルケニレン基としては、例えば、ビニレン基、プロペニレン、1,3-ブタジエニレン基等があげられる。

本発明において、ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及び
5 ヨウ素原子があげられる。

本発明において、ピリジル基は、2-ピリジル基、3-ピリジル基及び4-ピリジル基を含み、フリル基は、2-フリル基及び3-フリル基を含み、チエニル基は、2-チエニル基及び3-チエニル基を含み、ナフチル基は、1-ナフチル基及び2-ナフチル基を含む。

10 本発明において、脱離基としては、例えば、メシルオキシ基等のアルキルスルホニルオキシ基、例えば、トシルオキシ基等のアリールスルホニルオキシ基、例えば、メトキシスルホニルオキシ基等のアルコキシスルホニルオキシ基、例えば、臭素原子等のハロゲン原子等があげられる。

15 式 (I) ~ (III) で示されるシンナモイル化合物 (以下、各々、本発明化合物 (I) ~ (III) と記すこともある)、式 (IV) 及び (V) で示される2H-ピラン-2-オン化合物 (以下、各々、本発明化合物 (IV) 及び (V) と記すこともある)、式 (VI) で示される2H-ピラン-2-オン化合物 (以下、本発明中間体 (VI) と記すこともある)、式 (X) 及び (XI) で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物 (以下、各々、
20 本発明化合物 (X) 及び (XI) と記すこともある)、式 (XII) で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物 (以下、本発明中間体 (XII) と記すこともある)、式 (XV) 及び (XVI) で示される2(1H)-ピリジノン化合物 (以下、各々、本発明化合物 (XV) 及び (XVI) と記すこともある) 及び式 (XIX) 及び (XX) で示される2(1H)-キノリノン化合物 (以下、各々、本発明化合物 (XIX) 及び (XX) と記すこともある) に
25 おいて、A環がピリジン環の場合は、そのN-オキシドも含む。

本発明化合物 (I) ~ (V)、(VII)、(VIII)、(X)、(XI)、(XIII)、(XV) ~ (XXII) (以上を総称して、以下、本発明化合物と記すこともある) は、そ

これらの薬理学上許容されうる塩も、同時に表す。薬理学上許容されうる塩とは、本発明化合物の、無機酸との塩、有機酸との塩、無機塩基との塩又は有機塩基との塩を表す。無機酸との塩とは、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩等があげられ、有機酸との塩とは、例えば、酢酸塩、安息香酸塩等があげられ、無機塩基との塩とは、例えば、カリウム塩、ナトリウム塩等があげられ、有機塩基との塩とは、例えば、ピリジン塩、モルホリン塩等があげられる。

本発明化合物 (II) における Y_{A0} 、 Q_{A0} 、 K_{A0} 、 L_{A0} 及び T_{A0} は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、 (b_0) 、 (c_0) 、 (d_0) 、 (e_0) 、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_{b0} 、 M_{c0} 、 M_{d0} 、 R_{a0} 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

本発明化合物 (III) における Y_A 、 Q_A 、 K_A 、 L_A 及び T_A は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、 (b) 、 (c) 、 (d) 、 (e) 、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_b'''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

本発明化合物 (IV) 及び (V)、及び、本発明中間体 (VI) における X_a 、 Y_a 、 X_b 、 Y_b 、 X_c 、 Y_c 、 Q_A 、 Q_A' 及び L_a は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、 (b) 、 (c) 、 (d) 、 (e) 、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_b'''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

- 5 本発明化合物 (X) 及び (XI)、及び、本発明中間体 (XII) における X_d 、 Y_d 、 X_e 、 Y_e 、 Q_A 、 Q_A' 及び M_a' は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、(b)、(c)、(d)、(e)、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_b'''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

- 15 本発明化合物 (XV) 及び (XVI) における Y_f 、 X_g 、 Y_g 、 Q_A 、 T_A 及び L_a は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、(b)、(c)、(d)、(e)、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_b'''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

- 20 本発明化合物 (XIX) 及び (XX) における Y_f 、 X_h 、 Y_h 、 Q_A 、 T_A 及び M_a' は、互いに独立に、 D_1 、 D_2 、 D_3 、 D_4 、 D_5 、 R_0 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_4' 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 A_7 、 A_7' 、 A_7'' 、 A_8 、 A_8' 、 A_9 、 A_9' 、 B_0 、 B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 、 B_4' 、 B_6 、(b)、(c)、(d)、(e)、 M_a 、 M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 、 M_a'''' 、 M_b 、 M_c 、 M_d 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_d' 、 R_e 、 R_e' 、 R_e'' 、 R_e''' 、 R_e'''' 、 B_a 、 B_b 、 B_c 、 Y_a 、 Y_a' 、 Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 、 Y_b''' 、 Y_b'''' 、 Y_c 及び Y_c' で表される基、及び、 k 、 k' 、 l 、 m 、 m' 及び n で表される整数によって表される。

本発明化合物 (I) の Y_a のとりうる置換基 Y_0 群において、「6-10員環のア
リール基」とは、単環又は縮合環の芳香族炭化水素環をなす基を表し、例えば、フ
エニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、6-インダニル基等があげられ、「
5 5-10員環のヘテロアリール基」とは、単環又は縮合環の芳香族複素環をなす基
を表し、例えば、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基
2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-キノリル基等があげられ
、「不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基
」とは、単環又は縮合環を含み、2-シクロヘキセニル基、2-モルホリニル基、
10 4-ピペリジル基等があげられ、これらは単数又は同一又は相異なる複数の前記の
 M_a -基で置換されてもよい。

本発明化合物 (I) の Y_a のとりうる置換基 Z_0 群において、「A環と縮環する基
」は、ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10ア
ルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフ
15 ィニル基若しくはスルホニル基から選ばれる、単数又は同一又は相異なる複数の原
子又は基を有してもよい。

本発明化合物 (I) 及び (II) の、 Y_a 及び Y_{A0} のとりうる置換基 Y_0 群の (d_0)
において、「カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チ
20 オ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しく
はスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす」は、炭素原子
の一つ又は複数が、カルボニル基又はチオカルボニル基で置き換えられ、更に、炭
素原子の一つ又は複数が、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の
意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基から選ばれた、単数又は同
25 一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよい5-12員の炭化水素環をなすこ
とを表す。

本発明化合物 (I) 及び (II) の、 Y_a 及び Y_{A0} のとりうる置換基 Y_0 群の (e_0)
において、「カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (

- R_1 は、前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。」とは、炭素原子の一つ又は複数
 が、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、
 前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若しくはスルホニル基から選ばれた
 5、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよい5-12員の炭化水
 素環をなすことを表す。

本発明化合物 (I) の Y_a のとりうる X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属する基を、各々、
 、下記の表X、表Y及び表Zに例示する。

- 10 本発明化合物 (II) の Y_{A0} のとりうる X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属する基を、各々、
 下記の表X、表Y及び表Zに例示し、 Q_0 及び T_0 を、各々、下記の表Q及び表
 Tに例示する。

- 本発明化合物 (III) の Y_A のとりうる X 群、 Y 群及び Z 群に属する基を、各々、
 下記の表X、表Y及び表Zに例示し、 Q 及び T を、各々、下記の表Q及び表Tに例
 15 示する。

前記の、 X_0 群～ Z_0 群及び X 群～ Z 群に属する基を、以下の表X～表Zに例示するが、幾何異性が可能な基の場合はその全ての幾何異性体を意味し、互変異性が可能な基の場合はその全ての互変異性体を意味する。

- 20 X_0 群及び X 群に属する基を、表Xに例示する。

表X

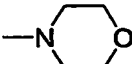
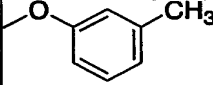
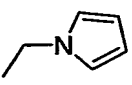
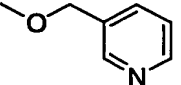
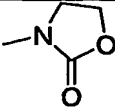
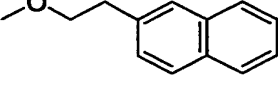
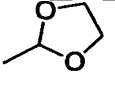
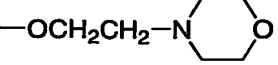
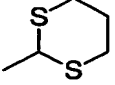
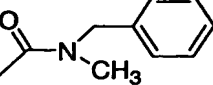
No.	基	No.	基
X-1	$-\text{CH}_3$	X-18	$-\text{OCF}_2\text{CHF}_2$
X-2	$-\text{C}_2\text{H}_5$	X-19	$-\text{SCF}_3$
X-3	$-\text{CF}_3$	X-20	$-\text{CH}_2\text{OCH}_3$
X-4	$-\text{CH}=\text{CHCH}_3$	X-21	$-\text{COCH}_3$
X-5	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	X-22	$-\text{OCOCH}_3$
X-6	$-\text{C}\equiv\text{CH}$	X-23	$-\text{COOH}$

(表 X 続き)

X-7	-F	X-24	-COOCH ₃
X-8	-Cl	X-25	-CH=CHCOOH
X-9	-Br	X-26	-N(CH ₃) ₂
X-10	-NO ₂	X-27	-NHCOCH ₃
X-11	-CN	X-28	-NHCOOCH ₃
X-12	-OCH ₃	X-29	-CONH ₂
X-13	-SCH ₃	X-30	-CON(CH ₃) ₂
X-14	-SOC ₄ H ₉	X-31	-NHCON(CH ₃) ₂
X-15	-SO ₂ C ₄ H ₉	X-32	-NHC(=NH)NH ₂
X-16	-OCHF ₂	X-33	-NHSO ₂ CF ₃
X-17	-OCF ₃	X-34	-SO ₂ N(CH ₃) ₂

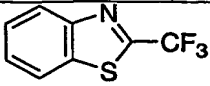
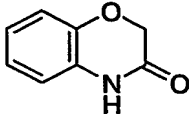
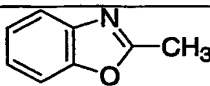
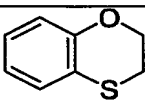
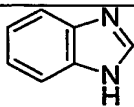
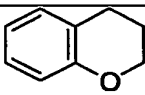
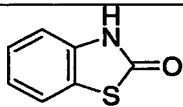
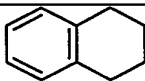
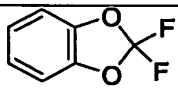
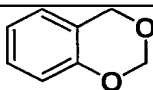
Y₀群及びY群に属する基を、表Yに例示する。

表Y

No.	基	No.	基
Y-1		Y-6	
Y-2		Y-7	
Y-3		Y-8	
Y-4		Y-9	
Y-5		Y-10	

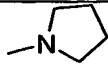
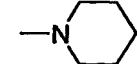
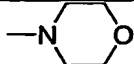
Z₀群又はZ群と縮環したA環を、表Zに例示する。

表Z

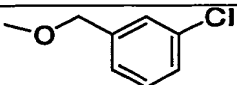
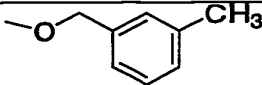
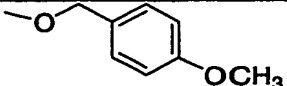
No.	基	No.	基
Z-1		Z-6	
Z-2		Z-7	
Z-3		Z-8	
Z-4		Z-9	
Z-5		Z-10	

5 Q_{A0}及びQ_Aを、表Qに例示する。

表Q

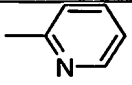
No.	基
Q-1	-OH
Q-2	
Q-3	
Q-4	
Q-5	-OCOCH ₃
Q-6	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂

(表Q続き)

Q-7	$-\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
Q-8	$-\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
Q-9	$-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
Q-10	$-\text{OCH}_3$
Q-11	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2 \text{ (c) } \text{C}_6\text{H}_{11}$
Q-12	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
Q-13	$-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
Q-14	$-\text{OCH}_2\text{COOH}$
Q-15	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$
Q-16	$-\text{OCH}_2\text{CONH}_2$
Q-17	$-\text{OCH}_2\text{CN}$
Q-18	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
Q-19	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
Q-20	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Q-21	$-\text{OCH}_2\text{COCH}_3$
Q-22	$-\text{OCOC}_6\text{H}_5$
Q-23	$-\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$
Q-24	
Q-25	
Q-26	

T_{A0} 及び T_A を、表Tに例示する。

表T

No.	基
T-1	$-\text{H}$
T-2	$-\text{CH}_3$
T-3	$-\text{CH}_2\text{CH}_2$ (c) C_6H_{11}
T-4	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
T-5	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
T-6	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$
T-7	$-\text{CH}_2\text{COOH}$
T-8	$-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
T-9	$-\text{CH}_2\text{CONH}_2$
T-10	$-\text{CH}_2\text{CN}$
T-11	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
T-12	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
T-13	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
T-14	$-\text{CH}_2\text{COCH}_3$
T-15	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$
T-16	$-\text{Ph}$
T-17	

本発明化合物 (I) として、例えば、 Q_a が水酸基、 (b_0) -基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_9' -O-基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。) であり、同時に、 K_a が水素原子で L_a がメチル基である場合、又は、 K_a 及び L_a が1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

本発明化合物 (II) として、例えば、 Q_{A0} が水酸基、 (b_0) -基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_9' -O-基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。) であり、同時に、 K_{A0} が水素原子で L_{A0} がメチル基である場合、又は、 K_{A0}

及び L_{A_0} が1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

本発明化合物(III)として、例えば、 Q_A が水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)又は A_9' -O-基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)であり、同時に、 K_A が水素原子で L_A がメチル基である場合、又は、 K_A 及び

5 L_A が1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

本発明化合物(IV)として、例えば、 Q_A が水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)又は A_9' -O-基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)であり、同時に、 K_A が水素原子で L_A がメチル基である場合があげられる。

本発明化合物(X)として、例えば、 Q_A が水酸基、(b)-基((b)は、前記
10 と同一の意味を表す。)又は A_9' -O-基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)であり、同時に、 r が0である場合があげられる。

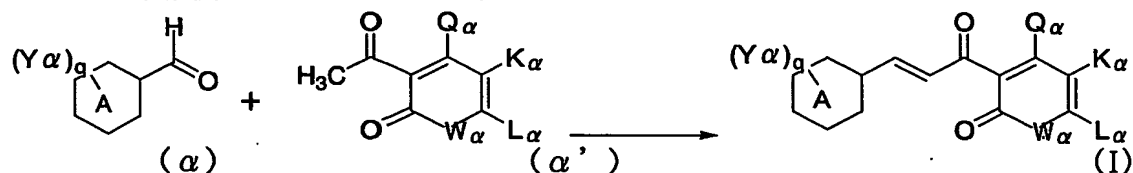
本発明化合物(XV)として、例えば、 Q_A が水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)又は A_9' -O-基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)であり、同時に、 K_A が水素原子で L_A がメチル基である場合があげられる。

15 本発明化合物(XIX)として、例えば、 Q_A が水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)又は A_9' -O-基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)であり、同時に、 r が0である場合があげられる。

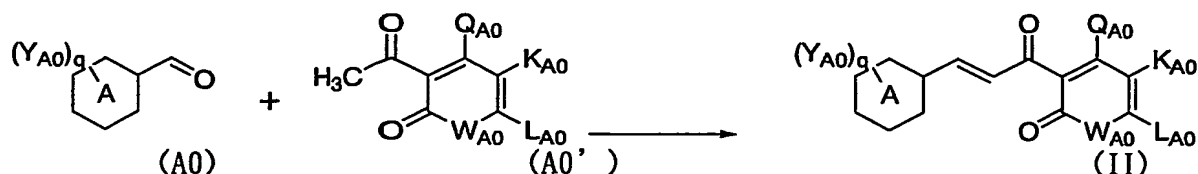
本発明化合物の一部は、例えば、Tetrahedron (1973), 29, 1
20 083、WO01/79187号公報、Zhurnal Prikladnoi Spektroskopii (1967), 7, 638)、Khimiya Geterotsiklicheskikh Soedinenii (1967), 4, 682、Chemical Papers (1997), 51, 33や、Synthetic Communications (2000), 30, 2735等の文献
25 に記載されており、公知である。しかしながら、これらの文献には、組織内におけるI型コラーゲン遺伝子の転写抑制の効果、ひいてはコラーゲン蓄積量抑制の効果についての記載は無い。

本発明化合物 (V)、(VI)、(XI)、(XII)、(XVI) 及び (XX) は新規化合物である。WO 97/35565 号公報、JP 09227547 号公報、WO 00/20371 号公報、JP 2002371078 号公報、WO 01/79187 号公報及び WO 92/18483 号公報にある種の概念的な骨格を有する化合物が開示されているが、本発明化合物と類似の構造を有する化合物の具体的な記載は何ら存在していない。また、当該文献には組織内における I 型コラーゲン遺伝子の転写抑制の効果、ひいてはコラーゲン蓄積量抑制の効果についての記載は無い。

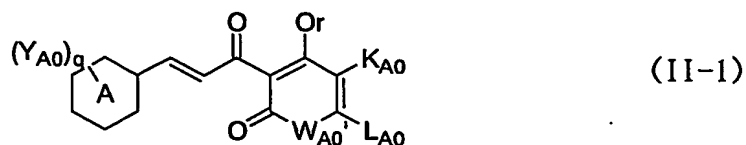
本発明化合物 (I) は、式 (α) (式中、A、Y_α 及び q は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 (α') (式中、Q_α、W_α、K_α 及び L_α は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させる (Russian J. General Chem. (2001), 71, 1257、Indian J. Chem. (1974), 12, 956 及び JP 50046666 号公報参照) ことにより製造することができる。



本発明化合物 (II) は、式 (A0) (式中、A、Y_{A0} 及び q は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 (A0') (式中、Q_{A0}、W_{A0}、K_{A0} 及び L_{A0} は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



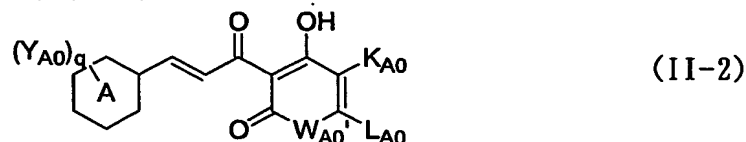
本発明化合物のうち、式 (II-1)



[式中、A、 Y_{A0} 、 q 、 K_{A0} 及び L_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 r は、 A_9' 一基（ A_9' は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 W_{A0}' は、酸素原子又は— NT_A' —基（ T_A' は、 A_9' 一基（ A_9' は、前記と同一の意味を表す。））、 D_5 — R_4 —基（ D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。）又は M_c —基（ M_c は、前記と同一の意味を表す。）を表す。]

で示されるシンナモイル化合物は、

式 (II-2)



[式中、A、 Y_{A0} 、 q 、 K_{A0} 、 L_{A0} 及び W_{A0}' は、前記と同一の意味を表す。]

で示されるシンナモイル化合物（以下、本中間体 (II-2) と記すこともある。）と

式 (II-3)



[r は、前記と同一の意味を表し、 V は脱離基を表す。]

で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応の方法としては、例えば、本中間体 (II-2) と化合物 (II-3) とを、塩基の存在下で反応させる方法をあげることができる。

本中間体 (II-2) と化合物 (II-3) との塩基の存在下での反応は、通常、溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、ヘキサメチルホスホラミド等のリン酸アミド化合物類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類等があげられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属の炭

酸塩類、酸化銀等があげられる。

化合物 (II-3) としては、例えば、メタンスルホン酸メチル等のアルキルスルホン酸エステル類、p-トルエンスルホン酸のメチルエステル、p-トルエンスルホン酸の2-メトキシエチルエステル等のアリールスルホン酸エステル類、ジメチル硫

5 酸等の硫酸エステル類、ヨウ化メチル、2-クロロエチルジメチルアミン、臭化アリル、臭化プロパルギル、プロモ酢酸メチル、プロモアセトニトリル、2-プロモエタノール、臭化ベンジル、プロモアセトン等のハライド類等があげられる。

反応に用いられる試剤の量は、本中間体 (II-2) 1 モルに対して、塩基は、通常、1 モル～2 モルの割合、化合物 (II-3) は、通常、1 モル～2 モルの割合である

10 。

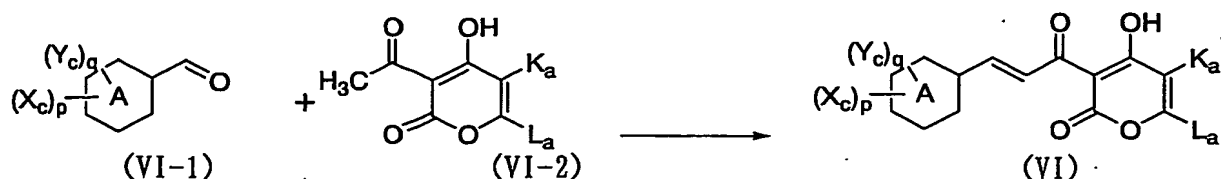
反応温度は、通常、0℃～100℃の範囲内、反応時間は、通常、1時間～200時間の範囲内である。

反応終了後、反応混合物を有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、シンナモイル化合物 (II-1) を単離することができる。単

15 離されたシンナモイル化合物 (II-1) はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

本発明中間体 (VI) は、式 (VI-1) (式中、A、X_c、Y_c、p 及び q は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 (VI-2) (式中、K_a 及び L_a は前

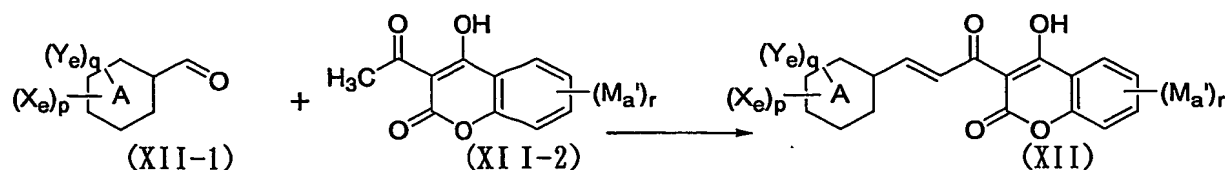
20 記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記の化合物 (A0) と化合物 (A0') との反応と同様に反応させることにより製造することができる。



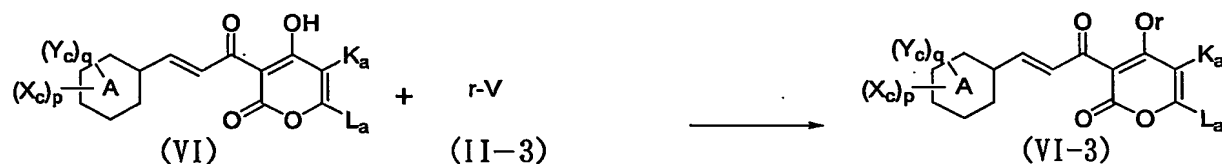
本発明中間体 (XII) は、式 (XII-1) (式中、A、X_e、Y_e、p 及び q は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 (XII-2) (式中、M_a' 及び r

25 は前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記の化合物 (A0) と化合

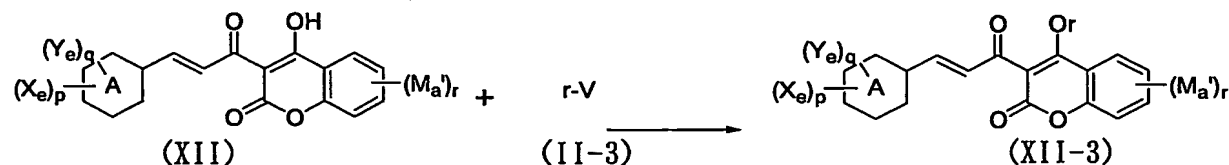
物 (A0') との反応と同様に反応させることにより製造することができる。



本発明化合物のうち、式 (VI-3) で示される2H-ピラン-2-オン化合物は、本発明
5 中間体 (VI) と、前記の化合物 (II-3) とを反応させることにより製造することが
できる。該反応は、本中間体 (II-2) と化合物 (II-3) との反応と同様にして行う
ことができる。



10 本発明化合物のうち、式 (XII-3) で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物
は、本発明中間体 (XII) と、前記の化合物 (II-3) とを反応させることにより製造
することができる。該反応は、本中間体 (II-2) と化合物 (II-3) との反応と同様
にして行うことができる。



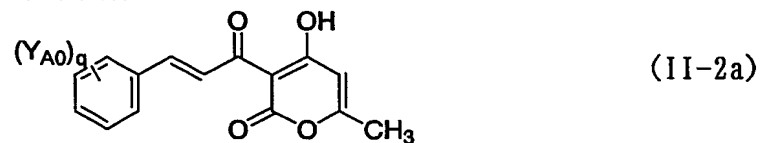
15

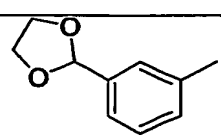
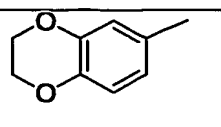
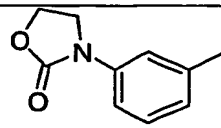
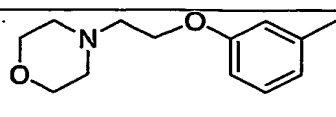
本発明中間体 (VI) 及び (XII) は新規化合物である。WO 97/35565号公
報、JP 09227547号公報、WO 00/20371号公報、JP 20023
71078号公報、WO 01/79187号公報及びWO 92/18483号公報
にある種の概念的な骨格を有する化合物が開示されているが、本発明中間体 (VI)
20 及び (XII) と類似の構造を有する化合物の具体的な記載は何ら存在していない。

本中間体 (II-2) のうち、化合物番号 (1 a-1) ~ (1 a-12) で表される本中間体 (II-2a) を表 1 a に例示する。

表 1 a

本中間体 (II-2a)

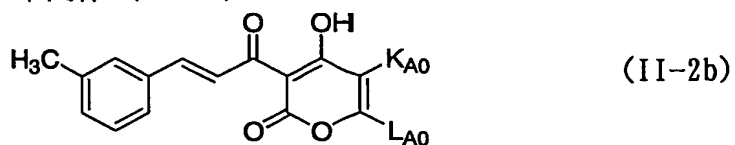


化合物番号	(Y _{A0}) _q
(1 a-1)	3-CH=CHCH ₃
(1 a-2)	3-C≡CH
(1 a-3)	3-CON(CH ₃) ₂
(1 a-4)	3-CH ₃ , 4-OCH ₃
(1 a-5)	3-CF ₃ , 4-Cl
(1 a-6)	3-Cl, 4-OCF ₃
(1 a-7)	3-F, 4, 5-(OCH ₃) ₂
(1 a-8)	3-COOCH ₃
化合物番号	(Y _{A0}) _q
(1 a-9)	
(1 a-10)	
(1 a-11)	
(1 a-12)	

本中間体 (II-2) のうち、化合物番号 (1 b-1) ~ (1 b-4) で表される本中間体 (II-2b) を表 1 b に例示する。

表 1 b

本中間体 (II-2b)

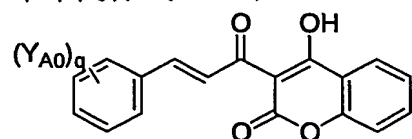


化合物番号	本中間体 (II-2b)
(1 b-1)	
(1 b-2)	
(1 b-3)	
(1 b-4)	

本中間体 (II-2) のうち、化合物番号 (1 c-1) ~ (1 c-12) で表される本中間体 (II-2c) を表 1 c に例示する。

表 1 c

本中間体 (II-2c)



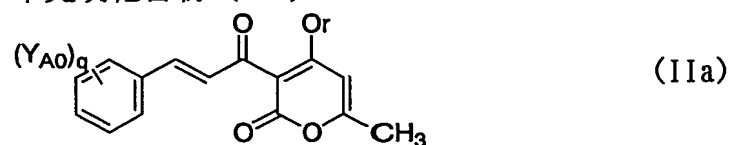
(II-2c)

化合物番号	(Y _{A0}) _q
(1 c - 1)	3 - CH=CHCH ₃
(1 c - 2)	3 - C≡CH
(1 c - 3)	3 - CON (CH ₃) ₂
(1 c - 4)	3 - CH ₃ , 4 - OCH ₃
(1 c - 5)	3 - CF ₃ , 4 - Cl
(1 c - 6)	3 - Cl, 4 - OCF ₃
(1 c - 7)	3 - F, 4, 5 - (OCH ₃) ₂
(1 c - 8)	3 - COOCH ₃
化合物番号	(Y _{A0}) _q
(1 c - 9)	
(1 c - 10)	
(1 c - 11)	
(1 c - 12)	

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (2 a - 1) ~ (2 a - 28) で表され
 5 る本発明化合物 (IIa) を、表 2 a に例示する。

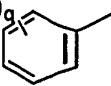
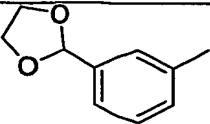
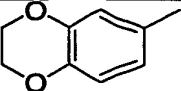
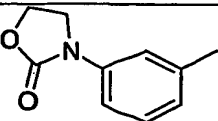
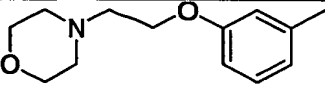
表 2 a

本発明化合物 (IIa)



化合物番号	(Y _{A0}) _q	r
(2 a - 1)	3 - CH=CHCH ₃	CH ₃
(2 a - 2)	3 - C≡CH	C ₂ H ₅
(2 a - 3)	4 - SCH ₃	CH ₃
(2 a - 4)	4 - S (O) CH ₃	CH ₃
(2 a - 5)	4 - S (O) ₂ CH ₃	CH ₃
(2 a - 6)	3 - CN	CH ₃
(2 a - 7)	4 - COOH	CH ₂ CH=CH ₂
(2 a - 8)	4 - COOCH ₃	CH ₃
(2 a - 9)	4 - N (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 a - 10)	3 - NHCOCH ₃	CH ₂ C≡CH
(2 a - 11)	3 - NHCON (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 a - 12)	3 - CONH ₂	CH ₃
(2 a - 13)	3 - CON (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 a - 14)	3, 4 - Cl ₂	CH ₃
(2 a - 15)	3 - CH ₃ , 4 - OCH ₃	CH ₃
(2 a - 16)	3 - CF ₃ , 4 - Cl	CH ₃
(2 a - 17)	3 - Cl, 4 - OCF ₃	CH ₃
(2 a - 18)	3 - F, 4, 5 - (OCH ₃) ₂	CH ₃
(2 a - 19)	3 - COOCH ₃	CH ₃

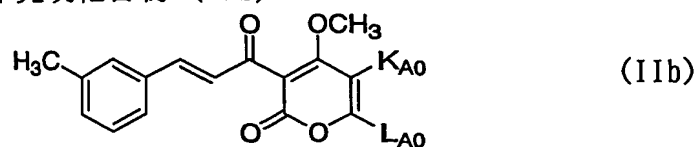
(表 2 a 続き)

化合物番号	$(Y_{A0})_q$ 	R
(2 a - 2 0)		CH_3
(2 a - 2 1)		CH_3
(2 a - 2 2)		CH_3
(2 a - 2 3)		CH_3
(2 a - 2 4)	3- CH_3	$CH_2CH_2OCH_3$
(2 a - 2 5)	3- CH_3	CH_2COOCH_3
(2 a - 2 6)	3- CH_3	$CH_2CH_2CH_2COCH_3$
(2 a - 2 7)	3- CH_3	CH_2CH_2OH
(2 a - 2 8)	3- CH_3	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (2 b - 1) ~ (2 b - 3) で表される本発明化合物 (IIb) を、表 2 b に例示する。

表 2 b

本発明化合物 (IIb)

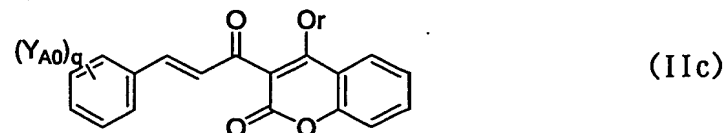


化合物番号	本発明化合物 (IIb)
(2 b - 1)	
(2 b - 2)	
(2 b - 3)	

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (2 c - 1) ~ (2 c - 23) で表され
 5 る本発明化合物 (IIc) を、表 2 c に例示する。

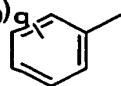
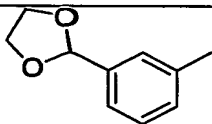
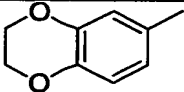
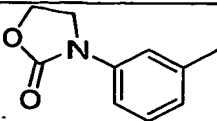
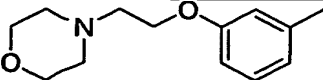
表 2 c

本発明化合物 (IIc)



化合物番号	(Y _{A0}) _q	r
(2 c - 1)	3 - CH=CHCH ₃	CH ₃
(2 c - 2)	3 - C≡CH	C ₂ H ₅
(2 c - 3)	4 - S CH ₃	CH ₃
(2 c - 4)	4 - S (O) CH ₃	CH ₃

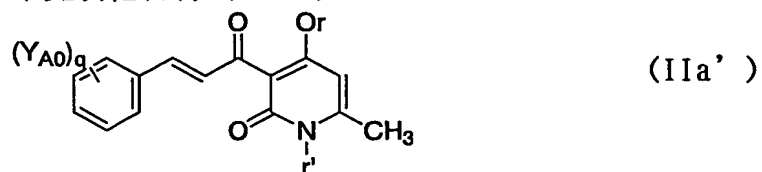
(表 2 c 続き)

(2 c - 5)	4 - S (O) ₂ CH ₃	CH ₃
(2 c - 6)	3 - CN	CH ₃
(2 c - 7)	4 - COOH	CH ₂ CH=CH ₂
(2 c - 8)	4 - COOCH ₃	CH ₃
(2 c - 9)	4 - N (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 c - 10)	3 - NHCOCH ₃	CH ₂ C≡CH
(2 c - 11)	3 - NHCON (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 c - 12)	3 - CONH ₂	CH ₃
(2 c - 13)	3 - CON (CH ₃) ₂	CH ₃
(2 c - 14)	3, 4 - Cl ₂	CH ₃
(2 c - 15)	3 - CH ₃ , 4 - OCH ₃	CH ₃
(2 c - 16)	3 - CF ₃ , 4 - Cl	CH ₃
(2 c - 17)	3 - Cl, 4 - OCF ₃	CH ₃
(2 c - 18)	3 - F, 4, 5 - (OCH ₃) ₂	CH ₃
(2 c - 19)	3 - COOCH ₃	CH ₃
化合物番号	(YA0) 	r
(2 c - 20)		CH ₃
(2 c - 21)		CH ₃
(2 c - 22)		CH ₃
(2 c - 23)		CH ₃

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (3 a-1) ~ (3 a-40) で表される本発明化合物 (IIa') を、表 3 a に例示する。

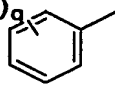
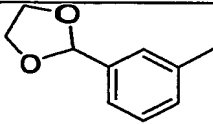
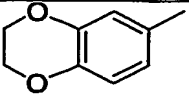
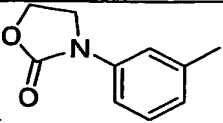
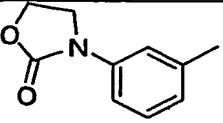
表 3 a

本発明化合物 (IIa')

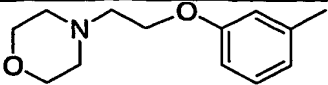
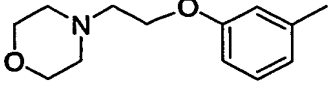


化合物番号	(Y _{A0}) _q	r	r'
(3 a-1)	H	H	H
(3 a-2)	H	H	CH ₃
(3 a-3)	H	CH ₃	CH ₃
(3 a-4)	3-C1	H	H
(3 a-5)	3-CH ₃	H	H
(3 a-6)	4-CF ₃	H	H
(3 a-7)	3-CH ₂ OCH ₃	H	H
(3 a-8)	3-CH=CHCH ₃	H	H
(3 a-9)	3-C≡CH	H	H
(3 a-10)	3-OC ₂ H ₅	H	H
(3 a-11)	4-SCH ₃	H	H
(3 a-12)	4-S(O)CH ₃	H	H
(3 a-13)	4-S(O) ₂ CH ₃	H	H
(3 a-14)	4-NO ₂	H	H
(3 a-15)	3-CN	H	H
(3 a-16)	4-COOH	H	H
(3 a-17)	4-COOCH ₃	H	H
(3 a-18)	4-N(CH ₃) ₂	H	H
(3 a-19)	3-NHCOCH ₃	H	H
(3 a-20)	3-NHCON(CH ₃) ₂	H	H

(表 3 a 続き)

(3 a - 2 1)	3 - CONH ₂	H	H
(3 a - 2 2)	3 - CON (CH ₃) ₂	H	H
(3 a - 2 3)	3 - OCHF ₂	H	H
(3 a - 2 4)	4 - OCF ₃	H	H
(3 a - 2 5)	4 - OCF ₂ CHF ₂	H	H
(3 a - 2 6)	2 - SCF ₃	H	H
(3 a - 2 7)	3, 4 - Cl ₂	H	H
(3 a - 2 8)	2, 4 - (OCH ₃) ₂	H	H
(3 a - 2 9)	3 - CH ₃ , 4 - OCH ₃	H	H
(3 a - 3 0)	3 - OC ₂ H ₅ , 4 - OH	H	H
(3 a - 3 1)	3 - CF ₃ , 4 - Cl	H	H
(3 a - 3 2)	3 - Cl, 4 - OCF ₃	H	H
(3 a - 3 3)	3 - F, 4, 5 - (OCH ₃) ₂	H	H
(3 a - 3 4)	3 - COOCH ₃	H	CH ₃
化合物番号	(Y _{A0}) ₉ 	r	r'
(3 a - 3 5)		H	CH ₃
(3 a - 3 6)		H	CH ₃
(3 a - 3 7)		H	H
(3 a - 3 8)		H	CH ₃

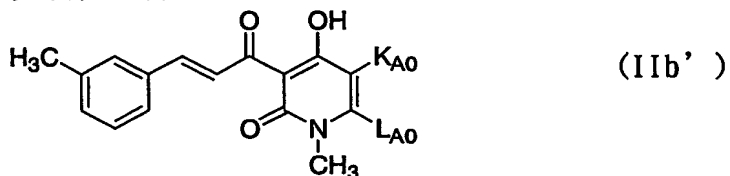
(表 3 a 続き)

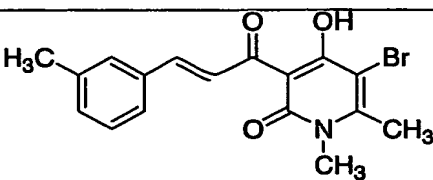
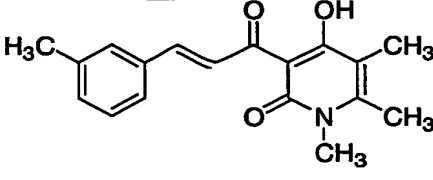
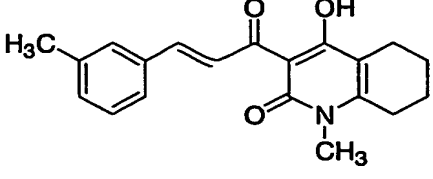
(3 a - 39)		H	H
(3 a - 40)		H	CH ₃

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (3 b - 1) ~ (3 b - 3) で表される本発明化合物 (IIb') を、表 3 b に例示する。

5 表 3 b

本発明化合物 (IIb')

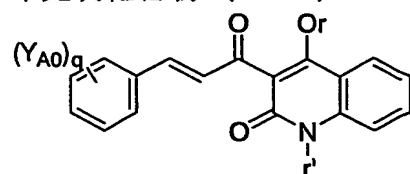


化合物番号	本発明化合物 (IIb')
(3 b - 1)	
(3 b - 2)	
(3 b - 3)	

本発明化合物 (II) のうち、化合物番号 (3 c - 1) ~ (3 c - 40) で表される本発明化合物 (IIc') を、表 3 c に例示する。

表 3 c

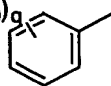
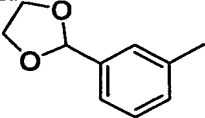
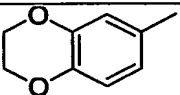
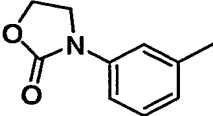
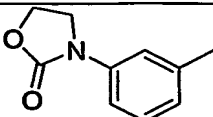
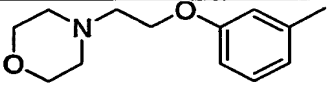
本発明化合物 (IIc')



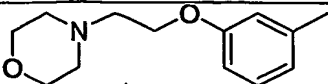
(IIc')

化合物番号	(Y _{AO}) _q	r	r'
(3c-1)	H	H	H
(3c-2)	H	H	CH ₃
(3c-3)	H	CH ₃	CH ₃
(3c-4)	3-C1	H	H
(3c-5)	3-CH ₃	H	H
(3c-6)	4-CF ₃	H	H
(3c-7)	3-CH ₂ OCH ₃	H	H
(3c-8)	3-CH=CHCH ₃	H	H
(3c-9)	3-C≡CH	H	H
(3c-10)	3-OC ₂ H ₅	H	H
(3c-11)	4-SCH ₃	H	H
(3c-12)	4-S(O)CH ₃	H	H
(3c-13)	4-S(O) ₂ CH ₃	H	H
(3c-14)	4-NO ₂	H	H
(3c-15)	3-CN	H	H
(3c-16)	4-COOH	H	H
(3c-17)	4-COOCH ₃	H	H
(3c-18)	4-N(CH ₃) ₂	H	H
(3c-19)	3-NHCOCH ₃	H	H
(3c-20)	3-NHCON(CH ₃) ₂	H	H
(3c-21)	3-CONH ₂	H	H
(3c-22)	3-CON(CH ₃) ₂	H	H

(表 3 c 続き)

(3 c - 2 3)	3-OCHF ₂	H	H
(3 c - 2 4)	4-OCF ₃	H	H
(3 c - 2 5)	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H
(3 c - 2 6)	2-SCF ₃	H	H
(3 c - 2 7)	3, 4-Cl ₂	H	H
(3 c - 2 8)	2, 4-(OCH ₃) ₂	H	H
(3 c - 2 9)	3-CH ₃ , 4-OCH ₃	H	H
(3 c - 3 0)	3-OC ₂ H ₅ , 4-OH	H	H
(3 c - 3 1)	3-CF ₃ , 4-Cl	H	H
(3 c - 3 2)	3-Cl, 4-OCF ₃	H	H
(3 c - 3 3)	3-F, 4, 5-(OCH ₃) ₂	H	H
(3 c - 3 4)	3-COOCH ₃	H	CH ₃
化合物番号	(Y _{A0}) ₉ 	r	r'
(3 c - 3 5)		H	CH ₃
(3 c - 3 6)		H	CH ₃
(3 c - 3 7)		H	H
(3 c - 3 8)		H	CH ₃
(3 c - 3 9)		H	H

(表 3 c 続き)

(3 c - 4 0)		H	CH ₃
-------------	---	---	-----------------

本発明化合物は、I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制する能力を有する。当該能力は、I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するために重要である。よって、本発明化合物は、I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための組成物（医薬品、化粧品、食品添加物等）の有効成分として利用することができる。

- 10 本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物の適用可能な疾患としては、例えば、コラーゲンの過度の集積により組織が線維化することにより硬化し、その結果、臓器等の組織の機能低下や瘢痕形成等を来す疾患（即ち、線維症等）をあげることができる。具体的には例えば、肝硬変、間質性肺疾患、慢性腎不全（又は慢性腎不全に陥る疾患）、炎症後の過形成痕跡、術後の瘢痕や熱傷性瘢痕、強皮症、
- 15 動脈硬化、高血圧等の疾患や異状等をあげることができる。因みに、肝硬変においては、1つの例として、C型又はB型肝炎ウイルスが慢性的な炎症を誘発し、TGF- β の量が上昇することにより、肝線維化（特に、I型・III型コラーゲンの蓄積）を引き起こして当該疾患となることがすでに知られている（例えば、Clin. Liver Dis., 7, 195-210 (2003) 参照）。間質性肺疾患に
- 20 おいては、1つの例として、ダニ・ウイルス・結核菌等による肺炎を誘発してTGF- β の量が上昇し、肺線維化を引き起こして当該疾患となると考えられている。糖尿病性腎症やIgA腎症等の慢性腎不全においては、前者では高血糖によって腎糸球体でTGF- β の量が上昇し、後者ではIgAが腎糸球体に蓄積することにより、腎炎を誘発してTGF- β の量が上昇し、腎線維化（特に、I型・IV型コラーゲンの蓄積）を引き起こして当該疾患となることがすでに示唆されている（例えば、
- 25 Am. J. Physiol. Renal Physiol., 278, F830-F

838 (2000)、Kidney Int., 64, 149-159 (2003) 参照)。尚、糖尿病性腎症のモデル動物であるdb/dbマウスとは、摂食を抑制するレプチン受容体に変異をもつため、過食により高血糖となり自然発症的に糖尿病を併発するものである。db/dbマウスは、正常マウスに比較して血中グルコース濃度が約4倍高く、腎糸球体線維化とTGF- β 量との増加が認められている(例えば、Am. J. Pathol., 158, 1653-1663 (2001) 参照)。またIgA腎症のモデル動物である抗Thy-1ラットとは、抗Thy-1抗体を正常ラットに投与することにより、人工的に腎線維化を引き起こさせたものである。当該モデル動物に対して抗TGF- β 受容体抗体を投与することにより、腎線維化が抑制されることが示されている(例えば、Kidney Int., 60, 1745-1755 (2001) 参照)。強皮症においては、その原因は不明だが、そのモデル動物であるTskマウスに対し、TGF- β 阻害剤を投与することにより皮膚線維化の改善が認められている(例えば、J. Invest. Dermatol., 118, 461-470 (2001) 参照)。以上のことから、TGF- β の作用を抑制する化合物は、TGF- β によるコラーゲン合成促進を阻害して組織の線維化を抑制し、線維症治療効果を得るための組成物(医薬品、化粧品、食品添加物等)の有効成分として利用することができるのである。

かかる本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。これらの組成物中に含有される本発明化合物は、通常、0.01重量%~99.99重量%であり、不活性担体は、通常、99.99重量%~0.01重量%である。該不活性担体は、薬学的に許容される担体や賦形剤であり、本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物はさらに、医薬品添加剤、化粧品添加剤、食品添加剤等を含有してもよい。

また、本発明化合物は、後述する実施例22にも示されるように、TGF- β が有するI型コラーゲン遺伝子の転写促進能力を阻害する。即ち、本発明化合物はTGF- β の作用を抑制する能力を有するTGF- β アンタゴニストである。よって、本発明化合物は、TGF- β 作用抑制組成物の有効成分として利用することもで

きる。TGF- β は、毛髪の成長サイクルにおける成長期（以下、毛髪成長期と記すこともある。）から退行期（以下、毛髪退行期と記すこともある。）への移行を促進する能力を有することが知られている [J. Invest. Dermatol., 111, 948-954 (1998)、FASEB J., 16, 1967-1969 (2002)]。さらに、抗TGF- β 抗体や、TGF- β 阻害剤であるFetuin等は、TGF- β による毛の伸長抑制作用に対して拮抗的に働き、毛の伸長促進作用を示すことが報告されている [J. Invest. Dermatol., 118, 993-997 (2002)、公開特許公報 特開2000-342296]。よって、本発明化合物（及びこれを有効成分として含有するTGF- β 作用抑制組成物）は、TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るために利用してもよい。

かかる本発明TGF- β 抑制組成物や本発明養毛組成物は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。これらの組成物中に含有される本発明化合物は、通常、0.01重量%～99.99重量%であり、不活性担体は、通常、99.99重量%～0.01重量%である。当該不活性担体は、薬学的に許容される担体や賦形剤であり、本発明TGF- β 抑制組成物や本発明養毛組成物はさらに、医薬品添加剤、化粧品添加剤、食品添加剤等を含有してもよい。

上記組成物に用いられる薬学的に許容される担体、賦形剤、医薬品添加剤、食品添加剤、化粧品添加剤等は、当該組成物の具体的用途に応じて適宜選択することができる。また、当該組成物の形態も、具体的用途に応じて、例えば、種々の固体、液体等の形態とすることができる。

例えば、本発明化合物を医薬品の有効成分として用いる場合には、具体的な形態として、例えば、散剤、細粒剤、顆粒剤、錠剤、シロップ剤、カプセル剤、懸濁化剤、エマルジョン剤、エキス剤及び丸剤等の経口剤、注射剤、外用液剤や軟膏剤等の経皮吸収剤、坐剤及び局所剤等の非経口剤等をあげることができる。

経口剤は、例えば、ゼラチン、アルギン酸ナトリウム、澱粉、コーンスターチ、白糖、乳糖、ぶどう糖、マンニット、カルボキシメチルセルロース、デキストリン

、ポリビニルピロリドン、結晶セルロース、大豆レシチン、ショ糖、脂肪酸エステル、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ポリエチレングリコール、ケイ酸マグネシウム、無水ケイ酸等の担体や賦形剤、結合剤、崩壊剤、界面活性剤、滑沢剤、流動性促進剤、希釈剤、保存剤、着色剤、香料、安定化剤、保湿剤、防腐剤、酸化防止剤等の医薬品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。

投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常は経口の場合にはヒト成人で1日あたり有効成分量として約1mg～約2g、好ましくは有効成分量として約5mg～約1gを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与

することができる。

非経口剤のうち、注射剤は、生理食塩水、滅菌水リンゲル液等の水溶性溶剤、植物油、脂肪酸エステル等の非水溶性溶剤、ブドウ糖、塩化ナトリウム等の等張化剤、溶解補助剤、安定化剤、防腐剤、懸濁化剤、乳化剤等の医薬品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。外用液剤、ゲル状軟膏等の経皮吸収剤、直腸内投与のための坐剤等も通常の方法に従って製造することができる。このような非経口剤を投与するには、注射（皮下、静脈内等）、経皮投与、直腸投与すればよい。局所剤は、例えば、本発明化合物をエチレンビニル酢酸ポリマー等の徐放性ポリマーのペレットに取り込ませて製造することができる。このペレットを治療すべき組織中に外科的に移植すればよい。

投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常は注射の場合にはヒト成人で有効成分量として約0.1mg～約500mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

本発明化合物を化粧品に添加して用いる場合には、当該化合物が添加された化粧品の具体的な形態としては、例えば、液状、乳状、クリーム、ローション、軟膏、ゲル、エアゾール、ムース等をあげることができる。ローションは、例えば、懸濁剤、乳化剤、保存剤等の化粧品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。

投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常ヒト成人で有効成分量として約0.01mg～約50mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

- 5 本発明化合物を食品添加物として用いる場合には、当該添加物が添加された食品の具体的な形態としては、例えば、粉末、錠剤、飲料、摂取可能なゲル若しくはシロップとの混合液状物、例えば、調味料、和菓子、洋菓子、氷菓、飲料、スプレッド、ペースト、漬物、ビン缶詰、畜肉加工品、魚肉・水産加工品、乳・卵加工品、野菜加工品、果実加工品、穀類加工品等の一般的な飲食物や嗜好物等をあげることができる。また、家畜、家禽、蜜蜂、蚕、魚等の飼育動物のための飼料や餌料への添加も可能である。

- 投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常ヒト成人で有効成分量として約0.1mg～約500mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

実施例

以下に実施例を挙げ、本発明を更に具体的に説明する。

実施例1 本中間体(II-2a) [化合物番号(1a-6)] の合成

- 20 3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オン 1. 85g、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド 2. 25g、クロロホルム 20ml 及びピペリジン 0.7ml の混合物を、還流下に4時間加熱した。室温に冷却した後、反応液を減圧濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィーに供した。得られた結晶をt-ブチルメチルエーテル 40ml で洗浄することにより、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号(1a-6)] の黄色結晶 0.40g を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 2.31 (s, 3H), 5.70 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.78

(s, 1H), 7.80 (d, 1H, $J=15.0\text{ Hz}$), 8.27 (d, 1H, $J=15.0\text{ Hz}$)

実施例2 本中間体 (II-2a) [化合物番号 (1a-9)] の合成

5 3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒドの代わりに、3-([1,3]ジオキソラン-2-イル)ベンズアルデヒド2.57gを用いた以外は実施例1と同様に
して、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-([1,3]ジオキソラン-2-イル)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (1a-9)] の淡黄色結晶0.38gを得た。

10 $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.29 (s, 3H), 4.04~4.17 (m, 4H), 5.84 (s, 1H), 5.96 (s, 1H), 7.44 (t, 1H, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.54 (d, 1H, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.70 (d, 1H, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.78 (s, 1H), 7.97 (d, 1H, $J=15.9\text{ Hz}$), 8.32 (d, 1H, $J=15.9\text{ Hz}$)

15

実施例3 本中間体 (II-2a) [化合物番号 (1a-10)] の合成

3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒドの代わりに、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-カルバルデヒド4.97gを用いた以外は実施例1と同様に
して、4-ヒドロキシ-3-[3-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (1a-10)]
20 の淡黄色結晶0.50gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.27 (s, 3H), 4.28~4.31 (m, 4H), 5.94 (s, 1H), 6.90 (d, 1H, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.21~7.24 (m, 2H), 7.88 (d, 1H, $J=15.6\text{ Hz}$), 8.17 (d, 1H, $J=15.6\text{ Hz}$), 12.19 (s, 1H)
25

実施例4 本中間体 (II-2b) [化合物番号 (1b-1)] の合成

3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒドの代わりに、*m*-トルアルデヒド、3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オンの代わりに、3-アセチル-5-プロモ-4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オンを用いた以外は実施例1と同様にして、5-プロモ-4-ヒドロキシ-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (1b-1)] の淡黄色結晶を得た。
5

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.40 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 7.25~7.34 (m, 2H), 7.49~7.51 (m, 2H), 8.05 (d, 1H, $J=15.9\text{ Hz}$), 8.30 (d, 1H, $J=15.9\text{ Hz}$)
10

実施例5 本中間体 (II-2b) [化合物番号 (1b-4)] の合成

3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オンの代わりに、3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-フェニル-2H-ピラン-2-オンを用いた以外は実施例1と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-フェニル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (1b-4)] を得た。
15

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.40 (s, 3H), 6.59 (s, 1H), 7.22~7.28 (1H), 7.32 (t, 1H, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.48~7.58 (m, 5H), 7.86~7.93 (m, 2H), 7.97 (d, 1H, $J=15.6\text{ Hz}$), 8.35 (d, 1H, $J=15.8\text{ Hz}$), 12.06 (s, 1H)
20

実施例6 本中間体 (II-2c) [化合物番号 (1c-6)] の合成

3-アセチル-4-ヒドロキシ-2H-1-ベンゾピラン-2-オン 2.25 g、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド 2.25 g、クロロホルム 20 ml 及びビペリジン 0.7 ml の混合物を、還流下に2時間30分間加熱した。室温に冷却した後、反応液を減圧濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィーに供した。得られた結晶を*t*-ブチルメチルエーテル 40 ml で洗浄することにより、4-ヒドロキシ-3-[
25

3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-2H-1-ベンゾピラン-2-オン [化合物番号 (1c-6)] の黄色結晶 1.49 g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 7.30~7.40 (3H), 7.63 (dd, 1H, J=2.2, 8.6 Hz), 7.72 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.81 (d, 1H, J=2.2 Hz), 7.91 (d, 1H, J=15.4 Hz), 8.10 (dd, 1H, J=1.6, 7.6 Hz), 8.41 (d, 1H, J=15.9 Hz), 18.64 (s, 1H)

実施例7 本発明化合物 (IIa) [化合物番号 (2a-17)] の合成

10 ヘキサメチルホスホラミド 4 ml に4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン 0.33 g を溶解し、この溶解物に水素化ナトリウム (60%油性) 50 mg を加え、室温で30分間攪拌した。次いで、ジメチル硫酸 0.2 ml を加えて、65℃で1時間、室温で一夜攪拌した。その後、反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出

15 した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することにより、4-メトキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン [化合物番号 (2a-17)] の淡黄色結晶 0.13 g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 2.31 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 5.99 (s, 1H), 7.16 (d, 1H, J=15.9 Hz), 7.32 (d, 1H, J=7.6 Hz), 7.47 (d, 1H, J=6.5 Hz), 7.53 (d, 1H, J=15.9 Hz), 7.68 (d, 1H, J=1.9 Hz)

20

25 実施例8 本発明化合物 (IIa) [化合物番号 (2a-20)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オンの代わりに、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-([1,3]ジオキサラン-2-イル)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-

オン0.35gを用いた以外は実施例7と同様にして、4-メトキシ-3-[3-[3-([1,3]ジオキソラン-2-イル)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号(2a-20)]の淡黄色油状物0.18gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.35 (s, 3H),
3.93 (s, 3H), 4.03~4.18 (m, 4H), 5.82 (s, 1H),
6.12 (s, 1H), 7.15 (d, 1H, $J=16.0\text{Hz}$), 7.39 (t, 1H, $J=7.7\text{Hz}$), 7.49 (d, 1H, $J=7.6\text{Hz}$), 7.57 (d, 1H, $J=7.6\text{Hz}$), 7.62 (d, 1H, $J=16.0\text{Hz}$), 7.68 (s, 1H)

実施例9 本発明化合物(IIa) [化合物番号(2a-24)]の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン0.81g、テトラヒドロフラン10ml、2-メトキシエタノール0.25ml、トリフェニルホスフィン0.87gの混合物に、ジエチルアゾジカルボキシレート0.57gのテトラヒドロフラン6ml溶液を滴下し、室温で一夜攪拌した。溶媒を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することにより、4-(2-メトキシエトキシ)-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号(2a-24)]の黄色油状物389mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.32 (s, 3H),
2.36 (s, 3H), 3.33 (s, 3H), 3.66 (t, 2H, $J=4.6\text{Hz}$),
4.25 (t, 2H, $J=4.6\text{Hz}$), 6.12 (s, 1H), 7.09 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$),
7.15~7.40 (4H), 7.56 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$)

実施例10 本発明化合物(IIa) [化合物番号(2a-25)]の合成

2-メトキシエタノールの代わりにグリコール酸メチル0.25mlを用いた以外は実施例9と同様にして、4-メトキシカルボニルメトキシ-3-[3-(3-メチルフェニル)

)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (2a-25)] 470mgを得た。

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 2.30 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 5.95 (s, 1H), 7.06 (d, 1H, J=16.2Hz), 7.20~7.80 (5H)

実施例11 本発明化合物 (IIa) [化合物番号 (2a-26)] の合成

2-メトキシエタノールの代わりに3-アセチル-1-プロパノール0.34mlを用いた以外は実施例9と同様にして、4-(3-アセチルプロポキシ)-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (2a-26)] 98mgを得た。

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 1.95~2.05 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.61 (t, 2H, J=6.6Hz), 4.15 (t, 2H, J=6.1Hz), 6.12 (s, 1H), 7.09 (d, 1H, J=16.2Hz), 7.15~7.40 (4H), 7.54 (d, 1H, J=16.2Hz)

実施例12 本発明化合物 (IIa) [化合物番号 (2a-27)] の合成

2-メトキシエタノールの代わりにエチレングリコールモノアセテート0.52mlを用いた以外は実施例9と同様にして、4-(2-ヒドロキシエトキシ)-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (2a-27)] 40mgを得た。

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 2.34 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.34 (t, 2H, J=6.4Hz), 3.88~3.92 (m, 2H), 4.26 (t, 2H, J=4.6Hz), 6.09 (s, 1H), 7.15~7.45 (m, 5H), 7.64 (d, 1H, J=16.1Hz)

実施例13 本発明化合物 (IIa) [化合物番号 (2a-28)] の合成

2-メトキシエタノールの代わりに2-(メチルスルホニル)エタノール0.32mlを用いた以外は実施例9と同様にして、4-(2-メチルスルホニルエトキシ)-3-[3-(3-メチルフェニル)-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (2a-28)] 137mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.38 (s, 6H), 3.05 (s, 3H), 3.42 (t, 2H, $J=5.6\text{Hz}$), 4.56 (t, 2H, $J=5.2\text{Hz}$), 6.12 (s, 1H), 7.13 (d, 1H, $J=16.1\text{Hz}$), 7.15~7.40 (4H), 7.55 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$)

実施例14 本発明化合物 (IIc) [化合物番号 (2c-17)] の合成

ヘキサメチルホスホラミド15mlに4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-2H-1-ベンゾピラン-2-オン1.37gを溶解し、この溶解物に水素化ナトリウム(60%油性)0.17gを加え、室温で30分間攪拌した。次いで、ジメチル硫酸0.8mlを加えて、65℃で2時間攪拌した。その後、反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をt-ブチルメチルエーテルで洗浄することにより、4-メトキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-2H-1-ベンゾピラン-2-オン [化合物番号 (2c-17)] の淡黄色結晶0.38gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 3.97 (s, 3H), 7.16 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$), 7.30~7.40 (2H), 7.48~7.55 (1H), 7.54 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$), 7.55~7.65 (2H), 7.71 (d, 1H, $J=1.9\text{Hz}$), 7.92 (dd, 1H, $J=1.4, 7.8\text{Hz}$)

実施例15 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-32)] の合成

3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 0.50 g、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド 0.74 g、ピリジン 6 ml 及びピペリジン 0.1 ml の混合物を、還流下に4時間加熱した。室温に冷却した後、反応液に水 40 ml を添加し、析出した結晶を濾取し、これをテトラヒドロフラン、続いて酢酸エチルで洗浄することにより、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-32)] の黄色結晶 0.41 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.22 (s, 3H), 5.90 (s, 1H), 7.60~7.70 (2H), 7.76 (d, 1H, $J=16.2\text{ Hz}$), 8.01 (s, 1H), 8.49 (d, 1H, $J=15.9\text{ Hz}$), 11.62 (s, 1H), 16.14 (s, 1H)

実施例 16 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-34)] の合成

ピリジン 2 ml 及びピペリジン 0.05 ml の混合物に、3-アセチル-4-ヒドロキシ-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン 0.23 g 及び 3-(メトキシカルボニル)ベンズアルデヒド 0.23 g を溶解し、還流下に2時間加熱した。室温に冷却後、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することにより、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(メトキシカルボニル)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-34)] の黄色結晶 0.06 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.41 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 6.07 (s, 1H), 7.63 (t, 1H, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.85 (d, 1H, $J=15.8\text{ Hz}$), 7.96~8.03 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 8.54 (d, 1H, $J=15.8\text{ Hz}$), 15.92 (broad s, 1H)

実施例 17 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-37)] の合成

3-[N-(*t*-ブトキシカルボニル)アミノ]ベンズアルデヒド 2.93 g のジメチルホ

ルムアミド 20 ml 溶液に水素化ナトリウム (60%油性) 0.58 g を氷冷下で添加した。室温で 1 時間攪拌した後、2-プロモエタノール 0.93 ml のジメチルホルムアミド 5 ml 溶液を氷冷下で滴下した。室温で 14 時間攪拌した後 115℃で 6 時間加熱攪拌した。酢酸エチルを加えて水、飽和食塩水の順で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することにより、油状の 3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒド 0.75 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 4.10~4.16 (m, 2H), 4.44~4.51 (m, 2H), 7.61~7.71 (m, 2H), 7.86~7.91 (m, 1H), 8.10~8.12 (m, 1H), 10.03 (s, 1H)

3-アセチル-4-ヒドロキシ-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノンの代わりに、3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 0.33 g、3-(メトキシカルボニル)ベンズアルデヒドの代わりに、3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒド 0.30 g を用いた以外は実施例 16 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-37)] の黄色結晶 0.22 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.21 (s, 3H), 4.11 (t, 2H, $J=7.5$ Hz), 4.47 (t, 2H, $J=7.5$ Hz), 5.89 (s, 1H), 7.38~7.53 (m, 2H), 7.65~7.69 (m, 1H), 7.81 (d, 1H, $J=15.0$ Hz), 7.89 (s, 1H), 8.53 (d, 1H, $J=15.0$ Hz), 11.57 (broad s, 1H)

25 実施例 18 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-38)] の合成

3-(メトキシカルボニル)ベンズアルデヒドの代わりに、3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒド 0.42 g を用いた以外は実施例 16 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)フェニル]-1-オキソ-

2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-38)] の黄色結晶 0.25 g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 2.41 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 4.09~4.15 (m, 2H), 4.44~4.50 (m, 2H), 6.06 (s, 1H), 7.48~7.53 (m, 2H), 7.65~7.69 (m, 1H), 7.80 (d, 1H, J=16.1 Hz), 7.89 (s, 1H), 8.50 (d, 1H, J=16.1 Hz), 16.03 (broad s, 1H)

10 実施例 19 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-39)] の合成

3-アセチル-4-ヒドロキシ-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノンの代わりに、3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 1.09 g、3-(メトキシカルボニル)ベンズアルデヒドの代わりに、3-(2-モルホリノエトキシ)ベンズアルデヒド 1.68 g を用いた以外は実施例 16 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(2-モルホリノエトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-39)] の黄色結晶 0.27 g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 2.21 (s, 3H), 2.47~2.50 (m, 4H), 2.71 (t, 2H, J=5.4 Hz), 3.58 (t, 4H, J=4.6 Hz), 4.14 (t, 2H, J=5.4 Hz), 5.88 (s, 1H), 7.05 (d, 1H, J=8.4 Hz), 7.24~7.41 (m, 3H), 7.77 (d, 1H, J=16.2 Hz), 8.50 (d, 1H, J=16.2 Hz), 11.56 (s, 1H), 16.42 (s, 1H)

実施例 20 本発明化合物 (IIa') [化合物番号 (3a-40)] の合成

25 3-(メトキシカルボニル)ベンズアルデヒドの代わりに、3-(2-モルホリノエトキシ)ベンズアルデヒド 4.87 g を用いた以外は実施例 16 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(2-モルホリノエトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (3a-40)] の黄色結晶 0.86 g を得た

。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.38 (s, 3H), 2.41~2.50 (m, 4H), 2.71 (t, 2H, $J=5.4\text{Hz}$), 3.32 (s, 3H), 3.57~3.60 (m, 4H), 4.14 (t, 2H, $J=5.4\text{Hz}$), 6.06 (s, 1H), 7.03~7.07 (m, 1H), 7.25~7.54 (m, 3H), 7.77 (d, 1H, $J=13.5\text{Hz}$), 8.46 (d, 1H, $J=16.2\text{Hz}$)

実施例21 本発明化合物 (IIc') [化合物番号 (3c-32)] の合成

10 3-アセチル-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン 0.60g、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド 1.99g、ピリジン 10ml 及びピペリジン 88 μl の混合物を、還流下に終夜加熱した。室温に冷却した後、反応液に水 50ml を添加し、析出した結晶を濾取し、これをテトラヒドロフラン 40ml、ヘキサン 60ml で洗浄することにより、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-クロロ-4-(トリフルオロメ
15 トキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-2(1H)-キノリノン [化合物番号 (3c-32)] の黄色結晶 0.92g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 7.26 (t, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 7.32 (d, 1H, $J=8.4\text{Hz}$), 7.65~7.75 (2H), 7.87 (d, 1H, $J=8.4\text{Hz}$), 7.87 (d, 1H, $J=1$
20 7.0Hz), 8.03 (d, 1H, $J=7.8\text{Hz}$), 8.07 (s, 1H), 8.60 (d, 1H, $J=15.9\text{Hz}$), 11.56 (s, 1H), 17.71 (s, 1H)

実施例22 (I型コラーゲン遺伝子の転写調節領域と結合されたレポーター遺伝子
25 を有するプラスミドの調製)

正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞 (Clontech社、カタログ番号 CC-2509) 1×10^8 細胞を 37℃、5% CO_2 雰囲気下で一晩培養した。培養された細胞をリン酸ナトリウム緩衝液 (以下、PBS と記す。) で 2 回洗浄した後、PBS

3mlを加えセルスクレイパー (Nalgen、カタログ番号179693) を用いて細胞を器壁から剥がした。剥がされた細胞を遠心分離 (1, 500 rpm、4℃、15分間) により集め、これをPBS 20mlに懸濁して再度遠心分離した。得られた沈殿に、DNA Extraction Kit (Stratagene社、カタログ番号200600) のSolution 2を11ml、pronaseを4.8 μ lそれぞれ加えて60℃にて1時間振とうした後、得られた混合液を氷中に10分間放置した。次に、当該混合液に上記キットのSolution 3を4ml加えて混合した後、これを氷中に5分間放置した。遠心分離 (3, 000 rpm、4℃、15分間) し、上清を回収した。回収された上清に、当該上清1ml当たり2 μ lのRNaseを加え、37℃で15分間放置した。この混合液に、2倍容量のエタノールを加えて混合し、出現した白い糸状の物質 (ゲノムDNA) を回収した。回収されたゲノムDNAを70%エタノールで洗浄した後、風乾した。風乾されたゲノムDNAを10mM Tris-HCl, 1mM EDTA (pH 8.0) (以下、TEと記す。) 500 μ lに溶解した。

得られたゲノムDNA溶解液 (ゲノムDNA 1 μ g相当量) と、配列番号1で示される塩基配列からなるオリゴヌクレオチド及び配列番号2で示される塩基配列からなるオリゴヌクレオチド (10 pmol/ μ l) 各1 μ l、蒸留水 29 μ l、TaKaRa LA Taq (宝酒造社、カタログ番号RR002A) に添付されたbuffer 5 μ l、Mg²⁺溶液 5 μ l、dNTP mixture 5 μ l及びTaKaRa LA Taq (宝酒造社、カタログ番号RR002A) 0.5 μ lを混合した。得られた混合液を94℃、5分間保温した後、94℃、1分間次いで60℃、1分間さらに72℃、1分間の保温を1サイクルとしてこれを30サイクル行った。当該混合液を2%アガロースゲル電気泳動に供することにより、約0.5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをフェノール・クロロホルム処理した後、エタノール沈殿することによりDNAを回収した。回収されたDNAを超純水に溶解し、この溶解液にNheI 2.5 μ l及びHindIII 2.5 μ lを加え、37℃で3時間保温した。次いで、当該溶解液を2%アガロースゲル電気泳動に供することにより、約3.5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをエタノール

沈殿することにより再びDNA（以下、コラーゲンプロモーターDNAと記す。）を回収した。

一方、ホタルルシフェラーゼをコードする塩基配列を有するベクターpGL3（Promega社、カタログ番号E1751）をNheI及びHindIIIで消化した後、上記と同様にアガロースゲル電気泳動に供することにより、約5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをエタノール沈殿することにより再びDNAを回収した。回収されたDNAに蒸留水44 μ l、Alkaline Phosphatase（宝酒造、カタログ番号2120A）に添付されたBuffer 5 μ l及びAlkaline Phosphatase（宝酒造社、カタログ番号2120A）1 μ lを加えて、この混合液を65℃で30分間保温した。次に、当該混合液を2回フェノール・クロロホルム処理した後、エタノール沈殿することによりDNA（以下、LucベクターDNAと記す。）を回収した。次いで、上記コラーゲンプロモーターDNA 約20 ngとLucベクターDNA 約20 ngとを混合した後、DNA Ligation kit Ver 2 酵素溶液を同量添加して16℃で一昼夜保温した。当該混合液に大腸菌5 Hd α （TOYOBO社、カタログ番号DNA-903）を加えて水中に30分間放置し、次いで42℃、45秒間保温した後、得られた大腸菌を50 μ g/ml アンピシリンナトリウム（ナカライ社、カタログ番号027-39）を含むLBプレートに播種し、37℃、一昼夜放置した。出現したシングルコロニーを50 μ g/ml アンピシリンを含むLB培地2 mlで37℃、12時間培養した。得られた培養液からAUTOMATIC DNA ISOLATION SYSTEM PI-50（KURABO社）を用いてプラスミドDNAを調製した。調製されたプラスミドDNAの塩基配列をDNAシーケンサーで分析した。その結果、当該プラスミド（以下、COL-Lucと記す。）は、ヒト由来のI型コラーゲン α 2鎖遺伝子の転写調節領域の-3500～+57（転写開始点を+1とする。）の塩基配列の下流に、レポーター遺伝子としてホタルルシフェラーゼのアミノ酸配列をコードする塩基配列が接続されてなる塩基配列を保有していることが確認された。

実施例23（レポーター遺伝子の発現量を指標とした被験化合物が有するI型コラーゲン遺伝子の転写調節能力の測定）

正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞 1×10^6 細胞を100mmディッシュに播種し、非働化牛胎児血清（以下、FBSと記す。Gibco社、カタログ番号21140-079）を10（v/v）%含むDulbecco's-MEM（日水製薬社、カタログ番号05919）培地（以下、当該培地をD-MEM（+）と記す。）中で37℃、5%CO₂雰囲気下において一晚培養した。次いで培地を、FBSを含まないDulbecco's-MEM培地（以下、当該培地をD-MEM（-）と記す。）に置換した。

10 D-MEM（-）300 μ lに、COL-Luc 5 μ g及びpCMV- β -gal（Invitrogen社、カタログ番号10586-014）5 μ gを加え、得られた混合液を室温で5分間放置した（溶液1）。また、D-MEM（-）300 μ lにLipofectine（Gibco社、カタログ番号18292-011）20 μ lを加え、得られた混合液を室温で45分間放置した（溶液2）。次に、溶液1と溶液2とを混合し、これを室温で10分間放置した後、当該混合液にD-MEM（-）5.4mlを加えて混合した。当該混合液を前記正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞に添加した後、当該細胞を37℃、5%CO₂雰囲気下で培養した。6時間後、ディッシュから培養上清を除き、細胞をPBSで2回洗浄した後、ディッシュに0.25%トリプシンを含むPBS 1mlを添加してディッシュから細胞を剥がした。剥がされた細胞にD-MEM（+）を加えてよく混合した後、当該混合物を12ウェルプレートに1mlずつ分注し、これを37℃、5%CO₂雰囲気下で終夜培養した。翌日、各ウェルをD-MEM（-）で2回洗浄した後、0.1% FBSを含むDulbecco's-MEM培地（以下、当該培地をD-MEM（0.1%）と記す。）1mlに置換した。

25 このようにして培養された細胞に、化合物番号（2a-17）、（2c-17）、（3a-32）及び（3c-32）、で示される本発明化合物をそれぞれ100 μ Mとなるようジメチルスルホキシド（以下、DMSOと記す。）に溶解させてなる溶液10 μ lを添加した（最終濃度1 μ M）。尚、対照ではDMSO10 μ lの

みを添加した。

1時間後、TGF- β (Pepr o Tech社) の0.5 μ g/ml水溶液又は蒸留水を10 μ l添加し、37℃、5%CO₂雰囲気下でさらに40時間培養した。

- 5 カタログ番号PD10) 200 μ lを加え細胞を剥がした。剥がされた細胞を細胞懸濁液として回収した後、これを遠心分離(15,000rpm、4℃、5分間)することにより、上清を回収した。回収された上清各50 μ lを96ウエルプレートに移した後、MICROLUMAT LB96P (EG&G BERTHOLD社製)を用いて、Lucアッセイ溶液(20mM Tricine (pH7.8)、
10 2.67mM MgSO₄、0.1mM EDTA、33.3mM DTT、270 μ M Coenzyme A、530 μ M ATP、470 μ M Luciferin) 50 μ lを当該プレートに自動分注した後、各ウエル内の発光量を測定した(Delay:1.6秒、Meas. Interval:20秒)。

- 一方、回収された上清又は細胞溶解剤50 μ lを、予め96ウエルプレートに分
15 注された β -gal基質溶液(5.8mM o-nitrophenyl- β -D-galactopyranoside、1mM MgCl₂、45mM 2-メルカプトエタノール) 50 μ lに加えて37℃、2時間インキュベートした後、マイクロプレートリーダーを用いて各ウエル内の420nmの吸光度を測定した。得られた値を基にし、次式に従って転写活性を算出した。

- 20 転写活性 = [発光量(上清添加区) - 発光量(細胞溶解剤添加区)] / [420nm吸光度(上清添加区) - 420nm吸光度(細胞溶解剤添加区)]

次に、算出された転写活性を基にし、次式に従って、TGF- β が有するI型コラーゲン遺伝子の転写促進能力に対する被験化合物の阻害効果を阻害度として算出した。

- 25 阻害度 = [転写活性(DMSO及びTGF- β 添加試験区) - 転写活性(化合物及びTGF- β 添加試験区)] / [転写活性(DMSO及びTGF- β 添加試験区) - 転写活性(DMSO及びTGF- β 無添加試験区)] × 100

化合物番号(2a-17)、(2c-17)、(3a-32)及び(3c-32)

）、で示される本発明化合物の阻害度は、いずれも70以上であった。これらの化合物が、TGF- β が有するI型コラーゲン遺伝子の転写促進能力を阻害し、I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制する能力を有することが確認された。

産業上の利用の可能性

- 5 本発明により、組織におけるI型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させ、コラーゲン蓄積量を低下させることにより、組織の線維化を改善させる組成物（即ち、コラーゲン蓄積抑制剤や線維症治療剤）等の開発・提供が可能となる。

配列表フリーテキスト

10 配列番号 1

コラーゲンプロモーターDNAを増幅するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー

配列番号 2

コラーゲンプロモーターDNAを増幅するために設計されたオリゴヌクレオチド

15 プライマー

配列番号 3

コラーゲンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー

配列番号 4

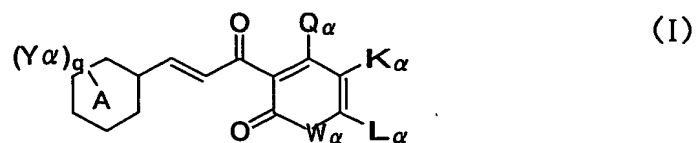
コラーゲンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー

20 配列番号 5

コラーゲンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチドプローブ

請求の範囲

1. 式 (I)



[式中、

5 I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表し、 $(Y_\alpha)_q$ において、 Y_α は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_0 群又は Y_0 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表して、 q が2以上のとき、 Y_α は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_α は、 Z_0 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X_0 群:

10 M_a -基 (M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。))

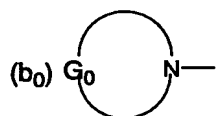
15 、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。))

20)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

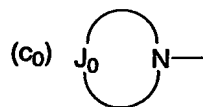
の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。] である。

10 (2) Y_0 群:

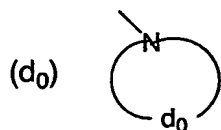
$M_{b0}-R_d$ -基 [M_{b0} は、 M_{c0} -基 (M_{c0} は、 $M_{d0}-R_d'$ -基 (M_{d0} は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



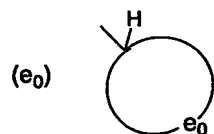
(b_0)-基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



(c_0)-基 ((c_0) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5-7員環をなす。)、



- (d₀)-基 {d₀は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 {R₁は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基 (R₂は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、B₁は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。}、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} 又は



10

- (e₀)-基 {e₀は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 (R₁は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} を表し、R_d' は、R_dと同一又は相異なり、R_dと同一の意味を表す。} を表す。}、M_{c0}-B_a-基 (M_{c0}及びB_aは、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-O-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}O-CO-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-基 (M_{c0}及びR_eは、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-NR_e-基 (M_{c0}及びR_eは、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}O-CO-NR_e-基 (M_{c0}及びR_eは、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-CO-基 (M_{c0}及びR_eは、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-CO-NR_e'-基 (M_{c0}、R_e及びR_e' は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-C(=NR_e')-NR_e'-基 (M_{c0}

、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0}-SO_2-NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{c_0}R_eN-SO_2$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

- 5 (3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、A環と縮環する基である。

- 10 I I. Q_a は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

I I I. W_a は、酸素原子又は $-NT_a$ -基 (T_a は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。

- I V. K_a 及び L_a は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、 K_a と L_a とは、置換基を有してもよいC1-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC1-C10アルケニレン基をなすことがある。

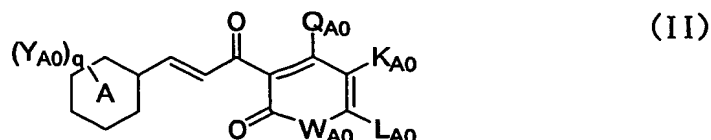
但し、A環がベンゼン環で、 W_a が酸素原子で、 L_a がメチル基で、 K_a が水素原子で、 Q_a がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_a が酸素原子で、

- 20 L_a がメチル基で、 K_a が水素原子で、 Q_a がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_a がハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 RB -基 (R は、C1-C4ハロアルキル基を表し、 B は、オキシ基又はチオ基を表す。) ではなく、またAがベン
- 25 ゼン環で、 W_a が酸素原子で、 L_a 及び K_a が1、3-ブタジエニレン基をなし、 Q_a がメトキシ基のとき、 q が1で Y_a がメトキシ基又はエトキシ基ではなく、またAがベンゼン環で、 W_a が酸素原子で、 L_a 及び K_a が1、3-ブタジエニレン基をなし、 Q_a が水酸基のとき、 q が1で Y_a がエトキシ基ではない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする I 型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

2. 式 (II)



10 [式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_{A0})_q$ において、 Y_{A0} は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_0 群及び Y_0 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_{A0} は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_0 群：

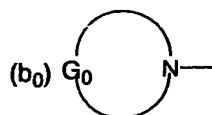
M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e -CO- R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e -CO-O

$-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。

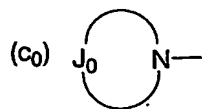
- 5)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
 15 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

(2) Y_0 群:

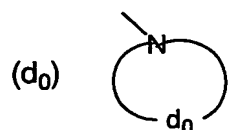
- $M_{b_0}-R_d$ -基 [M_{b_0} は、 M_{c_0} -基 (M_{c_0} は、 $M_{d_0}-R_d'$ -基 (M_{d_0} は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



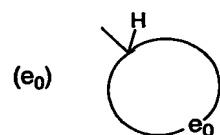
- (b₀)-基 ((b₀) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



(c₀)-基 ((c₀) において、J₀は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5-7員環をなす。) 、



- 5 (d₀)-基 { d₀は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 { R₁は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはR₂-B₁-基 (R₂は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、B₁は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。 } 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。 } 又は
- 10



- (e₀)-基 { e₀は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 (R₁は、前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。 } を表し、R_d' は、R_dと同一又は相異なり、R_dと同一の意味を表す。 } を表す。 } 、M_{c0}-B_a-基 (M_{c0}及びB_aは、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0}-CO-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0}-CO-O-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0}O-CO-基 (M_{c0}は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0}R_eN-基 (M
- 15
- 20

- c_0 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-CO-NR_e$ -基(M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}O-CO-NR_e$ -基(M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO$ -基(M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-CO-NR_e'$ -基(M_{c_0} 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}R_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_{c_0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0}-SO_2-NR_e$ -基(M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。))又は $M_{c_0}R_eN-SO_2$ -基(M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。
- 10 (3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、A環と縮環する基である。
- 15 III. Q_{A_0} は、水酸基、 (b_0) -基((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 { m は、0又は1を表し、 R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基(R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。))で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。}を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基(A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-SO_2-B_c$ -基((b_0) は、前記と同一の意味を表す。))
- 25

b_0) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $A_9' - B_c$ - 基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_5 - R_4 - B_c$ - 基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c0} - B_3 - B_c$ - 基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_{c0} 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{c0} - B_c$ - 基 (M_{c0} 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 (b_0) - R_4 - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 (c_0) - R_4 - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 (A_4 は、(b_0) - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。) 、 (c_0) - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ - 基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ - 基 (R_2 及び B_1 は

、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' 一基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 一基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4'$ 一基 ((b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4'$ 一基 ((c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4' 一基 (D_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' 一基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4' 一基 (A_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ 一基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' 一基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4' 一基 (D_5 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 一基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4'$ 一基 ((b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4'$ 一基 ((c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4' 一基 (D_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4' 一基 (R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4' 一基 (A_2 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O 一基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ 一基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 一基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ 一基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。)) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0 又は 1 を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は 0 となりかつ R_3 が水素原子となることはない。] を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ 一基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_1-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ 基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)-$ 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1N-(O)_{k'})$ 基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)-$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)-$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS- 基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2- 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b_0)-R_4$ 基 ((b_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4$ 基 ((c_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ 基 (A_4

は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} で置換された C1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)-$ 基(R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

5 、

2) $R_1-B_4-CO-R_4-B_4'-$ 基(R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2-R_4-B_4-$ 基(D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

10 3) $R_2-SO_2-NR_1-$ 基(R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) $(b_0)-$ 基((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) $(c_0)-$ 基((c_0) は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1A_1N-NR_1'-$ 基(R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

15 である。

IV. W_{A0} は、酸素原子又は $-NT_{A0}-$ 基 [T_{A0} は、水素原子、 $A_9'-$ 基(A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4- 基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は $M_{c0}-$ 基(M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。

20 V. K_{A0} は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_{A0} は、水素原子、C1-C10アルキル基又は $M_{b0}-$ 基(M_{b0} は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_{A0} と L_{A0} とは、C1-C10アルキレン基、又は、単数又は同一又は相異なる複数の M_a 基で置換されてもよいC1-C10アルケニレン基をなすことがある。但し、A環がベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} がメチル基で、 K_{A0} が水素原子で、 Q_{A0} がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} がメチル基で、 K_{A0} が水素原子で、 Q_{A0} がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_{A0} がハロゲン原子、又は、ハロ

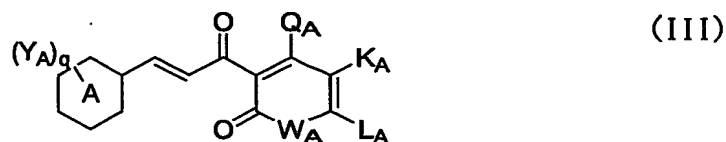
- ゲン原子もしくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C4ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）ではなく、またAがベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} 及び K_{A0} が1、3-ブタジエニレン基をなし、 Q_{A0} が
- 5 メトキシ基のとき、qが1で Y_{A0} がメトキシ基又はエトキシ基ではなく、またAがベンゼン環で、 W_{A0} が酸素原子で、 L_{A0} 及び K_{A0} が1、3-ブタジエニレン基をなし、 Q_{A0} が水酸基のとき、qが1で Y_{A0} がエトキシ基ではない。

- 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該
- 10 複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

15

3. 式 (III)



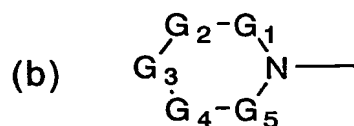
[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

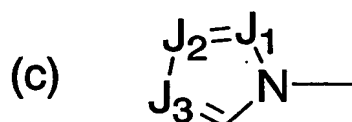
- II. $(Y_A)_q$ において、 Y_A は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又は
- 20 Y群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_A は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_A は、Z群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X群： M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよい

- C1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。
- (2) Y群: M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は、

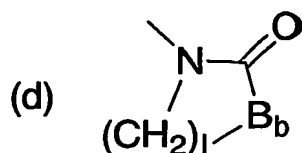


- (b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは
- 5 は $-NR_1-$ 基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1- 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、
- 10 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

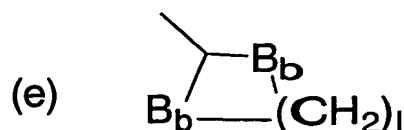


(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、

15



(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



- (e) -基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、
 10 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。
- 15 (3) Z 群: $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、
 20 C1-C10 アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10 アルキレン基を表す。) である。
- III. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9 、
 25 $-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)-$ 基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ 。

一基 (A_7' は、下記の A_7' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- SO_2-B_c -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' 基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群：水酸基又は A_1-O 基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ 基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ 基 (R_1' は、前記と

一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。)を表す。]である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)-$ 基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

- 5 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
- 10 又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)-$ 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-)$ $A_1 N-(O)_{k'}$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

- (iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)-$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)-$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は NH_2-CS- 基である。
- 15

(v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2- 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(vi) A_2 群:

- 20 1) A_3-B_4- 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m-$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b)-R_4-$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4-$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4-$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)]

25

- D_4-R_4 -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、
 5 前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、
 B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1)-$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]
- 10 2) $R_1-B_4-CO-R_4-B_4'$ -基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2-R_4-B_4$ -基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、
 3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、
 15 水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、
 4) (b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、
 5) (c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。) 又は
 6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 20 IV. W_A は、酸素原子又は $-NT_A$ -基 [T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。
 V. K_A は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_A は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、
 25 K_A と L_A とは、C1-C10アルキレン基又は $-C(M_a')=C(M_a'')-C(M_a''')=C(M_a'''')-$ 基 (M_a' 、 M_a'' 、 M_a''' 及び M_a'''' は、同一又は相異なり、 M_a と同一又は相異なり、水素原子又は M_a を表す。) をなすことがある。

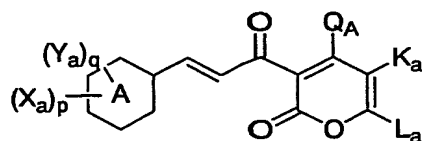
但し、A環がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A がメチル基で、 K_A が水素原子で、 Q_A がC1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基又はC3-C10アルキニルオキシ基のとき、 q が0ではなく、またA環がベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A がメチル基で、 K_A が水素原子で、 Q_A がC1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基又はC3-C10アルキニルオキシ基のとき、 q が1で Y_A がハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基、又は、 RB -基（ R は、C1-C10ハロアルキル基を表し、 B は、オキシ基又はチオ基を表す。）ではなく、またAがベンゼン環で、 W_A が酸素原子で、 L_A 及び K_A が1、3-ブタジエニレン基をなし、 Q_A が水酸基又はC1-C10アルコキシ基のとき、 q が1で Y_A がC1-C10アルコキシ基ではない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。」

で示されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

20 4. 式 (IV)

(IV)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_a)_p$ において、 X_a は、炭素原子上の置換基であって、ハロゲン原子

、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、C1-C10アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C10ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_a は同一又は相異なる。

- 5 III. $(Y_a)_q$ において、 Y_a は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_1 群又は Y_1 群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_a は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_a は、 Z_1 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X_1 群：

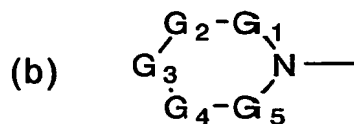
- 10 M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)]
- 15 、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 20)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 25)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)

’ ’ ’ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基(R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-R_e'-N-SO_2-R_d$ -基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。]である。

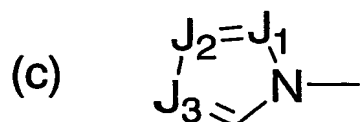
- 5 但し、 A がベンゼン環を表すとき、 X_a -基(X_a は、前記と同一の意味を表す。)を除く。

(2) Y_1 群:

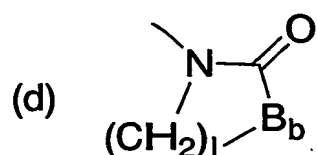
- M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基
10 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は



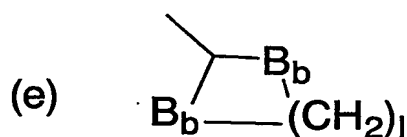
- (b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは
15 $-NR_1$ -基 { R_1 は、水素原子、又は、 C_1-C_{10} アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、 C_1-C_{10} アルキル基、 C_3-C_{10} アルケニル基又は C_3-C_{10} アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換された C_2-C_{10} アルキル基、又は、 C_3-C_{10} アルケニル基、又は、 C_3-C_{10} アルキニル基を表す。} で置換されてもよい C_1-C_{10} アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -
20 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい C_2-C_{10} アルケニレン基を表す。}、



(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、



5 (d) -基 (1 は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)
又は



(e) -基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。 } を表す。 } 、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_1 群 :

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。

- 5)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。) 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-
10 C10アルキレン基を表す。) である。

- IV. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)-$ 基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、
15 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一
20 の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ -基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一
25 の意味を表す。) 又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) である。

(1) A_7 群 :

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケ

- ニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 ー基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、
- 5 (b) ー R_4' ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 (c) ー R_4' ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 ー基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 10 (i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O ー基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ ー基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、
- 15 単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ ー基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。) を表す。] である。
- (ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ ー基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
- 20 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ ー基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
- 25 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ ー基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- (iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-)$ $A_1N-(O)_{k'}$ ー基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。) である。

(iv) D_2 群：シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N - (O)_n - A_1) -$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C (-OR_2) -$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は $NH_2 - CS -$ 基である。

(v) D_3 群：ニトロ基又は $R_1 OSO_2 -$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(vi) A_2 群：

1) $A_3 - B_4 -$ 基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m -$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b) - R_4 -$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4 -$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4 -$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4 -$ 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$ 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4 -$ 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4 -$ 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))若しくは $A_4 - SO_2 - R_4 -$ 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)]で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N ((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c)-基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

5 6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。]

V. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

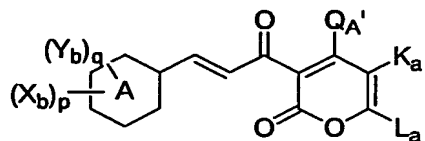
10 但し、 K_a が水素原子で L_a がメチル基でA環がベンゼン環のとき、 q が0の場合には p は2、3又は4である。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲
15 内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

20 5. 式 (V)

(V)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_b)_p$ において、 X_b は、炭素原子上の置換基であって、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C10アルコキシ基、又は、RB-基（Rは、C1-C10ハロアルキル基を表し、Bは、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、pは0、

5 1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_b は同一又は相異なる。

III. $(Y_b)_q$ において、 Y_b は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_2 群又は Y_2 群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_b は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_b は、 Z_2 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

10 (1) X_2 群：

M_a -基 [M_a は、 R_b -基（ R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。）、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基（ R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-

15 C10アルキレン基を表す。）、 HOR_d -基（ R_d は、前記と同一の意味を表す。）

、 R_e-CO-R_d -基（ R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_e-CO-O-R_d$ -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_eO-CO-R_d$ -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 R

20 $_eR_e'$ N- R_d -基（ R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。

）、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基（ R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基（ R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 R_eR_e' N-CO- R_d -基（ R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

25 の意味を表す。）、 R_eR_e' N-CO- $NR_e''-R_d$ -基（ R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 R_eR_e' N-C(=NR_e''')- $NR_e'''-R_d$ -基（ R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e''''

は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b - SO_2 - NR_e - R_d - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - R_e' - N - SO_2 - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)

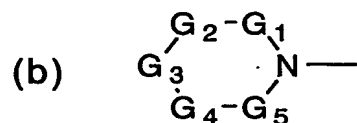
5 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基、又は、RB-基 (R及びBは、前記と同一の意味を表す。) を除く。

10 (2) Y_2 群:

M_b - R_d - 基 [M_b は、 M_c - 基 { M_c は、 M_d - R_d' - 基 { M_d は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は

15 、

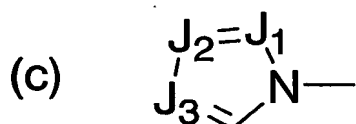


(b) - 基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは

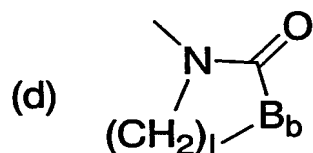
20 は - NR_1 - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2 - B_1 - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、

25 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは - NR_1 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC2-C10アルケニレン

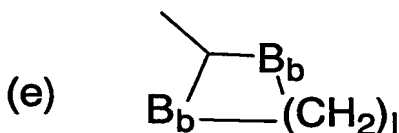
基を表す。}、



(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (l は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の

意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_2 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ
5 基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アル
キル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されて
もよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表
10 す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-
C10アルキレン基を表す。)である。

III. Q_A' は、(b) -基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基
又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (m
15 は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水
素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7''
は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を
表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1
20 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を
表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - SO_2-B_c -基 ((b)及
び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7'
群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し
25 、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル
基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味
を表す。)又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7 ' ' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ -基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。 } を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1N-(O)_k)$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同

一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N - (O)_n - A_1) -$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C (-OR_2) -$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $NH_2 - CS -$ 基である。

5 (v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 OSO_2 -$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) $A_3 - B_4 -$ 基

10 $[A_3$ は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m -$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b) - R_4 -$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4 -$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4 -$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4 -$ 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$ 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4 -$ 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4 -$ 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4 -$ 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N ((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

25 、

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B_4

₄は、前記と同一の意味を表す。）、

3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。）、

4) (b)-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。）、

5) (c)-基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。）又は

6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)である。]

IV. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

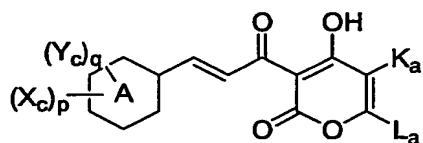
但し、A環がベンゼン環のとき、qが0の場合にはpは2、3又は4である。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物。

6. 式 (VI)

(VI)



20 [式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_c)_p$ において、 X_c は、炭素原子上の置換基であって、水酸基、又は

、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、 $R' - S(O)_1$ -基（ R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。）、又は、シアノ基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基、又は、アミノカルボニル基、又は、 $(R')_2N$ -基（ R' は、前記と同一の意味を表す。）、又は、 $R'CO-NH$ -基（ R' は、前記と同一の意味を表す。）、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基、又は、 RB -基（ R は、C1-C10ハロアルキル基を表し、 B は、オキシ基又はチオ基を表す。）を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_c は同一又は相異なる。

- 10 $III. (Y_c)_q$ において、 Y_c は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_3 群又は Y_3 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_c は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_c は、 Z_3 群の基をなしてA環と縮環してもよい。

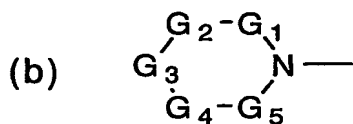
(1) X_3 群：

- 15 M_a -基 [M_a は、 R_b -基（ R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。）、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基（ R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。）、 HOR_d -基（ R_d は、前記と同一の意味を表す。）
- 20 、 R_eCO-R_d -基（ R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 R_eCOO-R_d -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_eO-CO-R_d$ -基（ R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基（ R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意
- 25 味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。）
- ）、 $R_eCO-NR_e'-R_d$ -基（ R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基（ R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。）、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基（ R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

- の意味を表す。)、 $R_e R_{e'} N-CO-NR_{e''}-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び $R_{e''}$ は、同一又は相異なり、 R_e 及び $R_{e'}$ は、前記と同一の意味を表し、 $R_{e''}$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_{e'} N-C(=NR_{e''})-NR_{e'''}-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 、 $R_{e''}$ 及び $R_{e'''}$ は、同一又は相異なり、 R_e 、 $R_{e'}$ 及び $R_{e''}$ は、前記と同一の意味を表し、 $R_{e'''}$ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_{e'} N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。
- 10 但し、Aがベンゼン環を表すとき、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、 $R'-S(O)_1$ -基 (R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。)、又は、シアノ基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基、又は、アミノカルボニル基、又は、 $(R')_2N$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R'CO-NH$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、ニトロ基、又は、C1-C10アルコキシ基を除く。

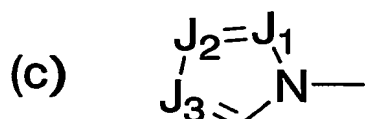
(2) Y_3 群:

- M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は、

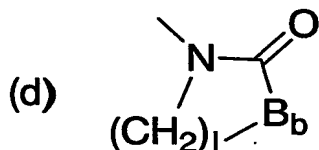


- (b)-基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは

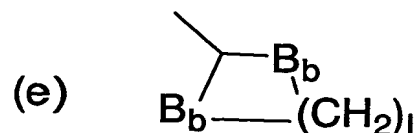
は—NR₁—基 {R₁は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子
若しくはR₂—B₁—基 (R₂は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-
C10アルキニル基を表し、B₁は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニ
ル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は
5、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、
メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは—NR₁—
基 (R₁は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン
基を表す。}、



(c) —基 ((c) において、J₁、J₂及びJ₃は、同一又は相異なり、メチル基
10 で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) —基 (l は、2、3又は4であり、B_bは、オキシ基又はチオ基を表す。)
又は



15

(e) —基 (l 及びB_bは、前記と同一の意味を表す。) を表し、R_d' は、R_dと
同一又は相異なり、R_dと同一の意味を表す。} を表す。}、M_c—B_a—基 (M_c及
びB_aは、前記と同一の意味を表す。)、M_c—CO—基 (M_cは、前記と同一の意
味を表す。)、M_c—CO—O—基 (M_cは、前記と同一の意味を表す。)、M_cO
20 —CO—基 (M_cは、前記と同一の意味を表す。)、M_cR_eN—基 (M_c及びR_eは

、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)
 5)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

但し、 p が0のとき、モルホリノ基、又は、フェニル基、又は、トリフルオロメチル基で置換されたフェノキシ基、又は、単数又は複数のハロゲン原子で置換されたフェノキシ基を除く。

(3) Z_3 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ
 15 基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表
 20 す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

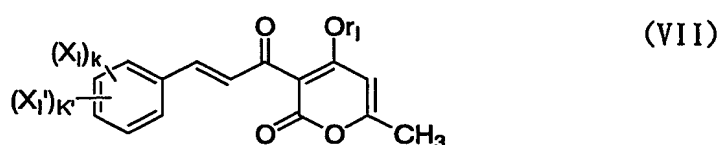
但し、 p が0のとき、 Y_c は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキサール環をなすことはない。

IV. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基(M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し
 25 、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはなく、A環がベンゼン環又はピリジン環のいずれの場合も、 p と q は同時に0となることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。】で示される2H-ピラン-2-オン化合物。

7. 式 (VII)

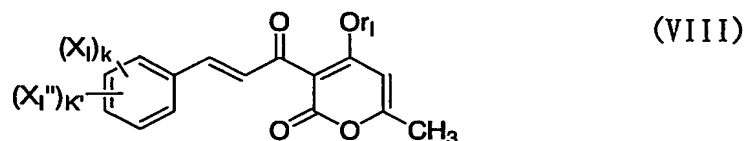


[式中、 X_1 はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、 $R_1-S(O)_1$ -基(R_1 はC1-C4アルキル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、シアノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_1)_2N$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1O-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1NH-CO-NH$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表す。))又は $(R_1')_2N-CO$ -基(R_1' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_1' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 RB -基(B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 k は0又は1を表し、 k' は0~4の整数を表し、 k が0の場合には k' は2~4の整数であり、 k' が2~4の場合には X_1' は相異なってよく、 r_1 はC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基である。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI

型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

8. 式 (VIII)

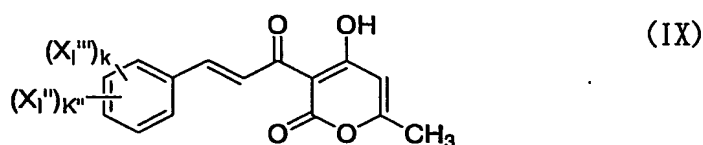


- [式中、 X_1 はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、 $R_1-S(O)_1$ -基 (R_1 はC1-C4アルキル基を表し、 1 は0~2の整数を表す。)、シアノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_1)_2N$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-CO-NH$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1O-CO-NH$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表す。)、 $R_1NH-CO-NH$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表す。)) 又は $(R_1')_2N-CO$ -基 (R_1' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)) を表し、 X_1'' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 RB -基 (B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)) を表し、 k は0又は1を表し、 k' は0~4の整数を表し、 k が0の場合には k' は2~4の整数であり、 k' が2~4の場合には X_1'' は相異なってよく、 r_1 はC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基である。

]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物。

9. 式 (IX)

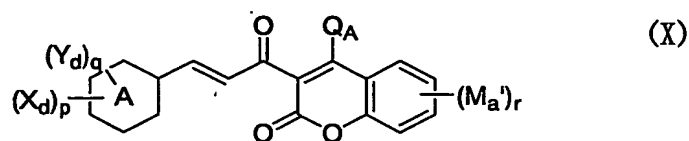


[式中、 X_1' はC2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、カルボキシ基、C2-C4アルコキシカルボニル基又は $(R_{11})_2N$ -基(R_{11} はC2-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_1'' はハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、ニトロ基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 RB -基(B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 k は0又は1を表し、 k' は0～2の整数を表し、 k が0の場合には k' は2であり、 k' が2の場合には X_1' は相異なる。]

で示される2H-ピラン-2-オン化合物。

10

10. 式 (X)



[式中、

I. A は、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_d)_p$ において、 X_d は、炭素原子上の置換基であって、メトキシ基又はエトキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。

III. $(Y_d)_q$ において、 Y_d は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_4 群又は Y_4 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_d は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は

相異なる Y_d は、 Z_4 群の基をなして、A 環と縮環してもよい。

(1) X_4 群:

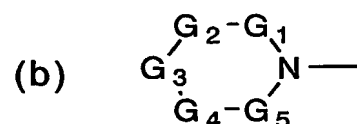
- M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -
- 5 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - O -
- 10 $-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_eO - CO - R_d -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 HO - CO - $CH=CH$ -基、 R_eR_e' - N - R_d -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - NR_e' - R_d -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_bO - CO - $N(R_e)$ - R_d -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_eR_e' - N - CO - R_d -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_eR_e' - N - CO - NR_e'' - R_d -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_eR_e' - N - $C(=NR_e''')$ - NR_e'''' - R_d -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b - SO_2 - NR_e - R_d -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_eR_e' - N - SO_2 - R_d -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 25 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

ただし、Aがベンゼン環を表すとき、メトキシ基及びエトキシ基を除く。

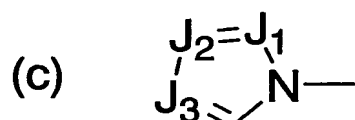
(2) Y_4 群:

M_b - R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d - R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a

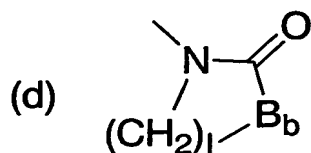
は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基
 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -
 一基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいナフチル基、又は



- 5 (b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子
- 10 若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。} で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -
- 15 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

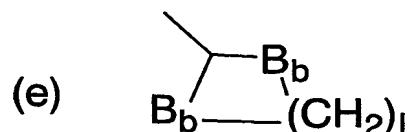


(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (1は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)

又は



- (e) ー基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a ー基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ ー基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ ー基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z_4 群:

- ー $N=C(Y_a)-Y_a'$ ー基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表す。)
 20)、ー $Y_b-Y_b'-Y_b''$ ー基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は ー Y_c-O-Y_c' ー O ー基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-

C10アルキレン基を表す。)である。

- IV. Q_A は、水酸基、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9 - B_6 - B_c - 基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (mは、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7'' - SO_2 - B_c$ - 基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2 - B_c$ - 基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N - SO_2 - B_c$ - 基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - $SO_2 - B_c$ - 基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9' - B_c$ - 基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - B_c$ - 基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - B_3 - B_c$ - 基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は $M_c - B_c$ - 基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

- 20 ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - R_4 - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、

前記と同一の意味を表す。}、 D_3-R_4 -基 { D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 { A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

- (i) D_4 群：水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C2-C10 アルケニル基、又は、C2-C10 アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10 アルキル基又は C2-C10 ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。)] を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0 又は 1 を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は 0 となりかつ R_3 が水素原子となることはない。} を表す。] である。
- 10 (ii) D_5 群： $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
 15 又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- (iii) D_1 群： $(R_1-(O)_k)-A_1 N-(O)_k$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。
- 20 (iv) D_2 群：シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS -基である。
- (v) D_3 群：ニトロ基又は $R_1 OSO_2$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。
- 25 (vi) A_2 群：
 1) A_3-B_4 -基
 [A_3 は、水素原子、又は、C1-C10 アルキル基、又は、C2-C10 ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10 アルケニル基、又は、ハロゲン原子で

置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及びmは前記と同一の意味を表す。)、又は、(b)- R_4 -基 ((b)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))若しくは $A_4 - SO_2 - R_4$ -基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基 (R_1 及びmは、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

15 、

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ -基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2 - R_4 - B_4$ -基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

20 3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

25 である。

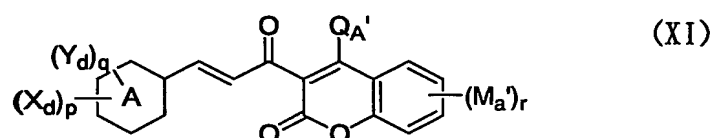
V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、rは0、1、2、3又は4を表す。

但し、A環がベンゼン環のとき、q及びrが0の場合にはpは2、3又は4である

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

10 1 1. 式 (XI)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_d)_p$ において、 X_d は、炭素原子上の置換基であって、メトキシ基又はエトキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。

III. $(Y_d)_q$ において、 Y_d は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_4 群又は Y_4 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_d は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_d は、 Z_4 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_4 群：

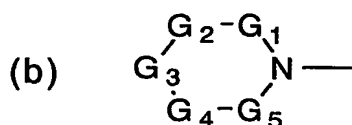
M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オ

- キシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O - R_d -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

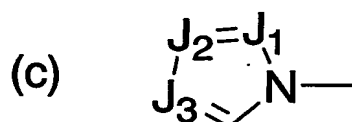
ただし、Aがベンゼン環を表すとき、メトキシ基及びエトキシ基を除く。

(2) Y_4 群:

- M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいナフチル基、又は、

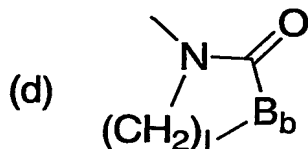


- (b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは
- 5 は $-NR_1-$ 基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、
- 10 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。}、

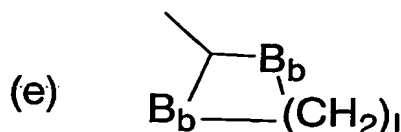


(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、

15



(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) ー基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a ー基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、
 10 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ ー基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ ー基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

15 (3) Z_4 群:

ー $N=C(Y_a)-Y_a'$ ー基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表す。)、
 20 ー $Y_b-Y_b'-Y_b''$ ー基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C4 アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよい C1-C4 アルキレン基を表す。) 又は ー $Y_c-O-Y_c'-O$ ー基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10 アルキレン基を表す。) である。

25 IV. Q_A' は、(b) ー基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ ー基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は ー $N((O)_mR_1)$ ー基 (m は、0 又は 1 を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水

- 素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- SO_2-B_c -基 ((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

- 15 ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 { D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 { D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、 D_3-R_4 -基 { D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 { A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は

、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群：水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群：ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' ー基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(4) A_8' 群：C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群：C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ ー基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' ー基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 ー基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' ー基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ ー基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ ー基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 ー基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 ー基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2-CO-R_4 ー基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群：水酸基又は A_1-O ー基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ ー基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は

、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。)を表す。]である。

- 5 (ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、
 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)
 10 又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基(R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1 N-(O)_k)$ -基(R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

- 15 (iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基(R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基(A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は NH_2-CS -基である。

(v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 OSO_2$ -基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

- 20 (vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

[A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基(R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b)-R_4$ -基((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4$ -基((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味

を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基(D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基(D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基(D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基(D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基(D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基(A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1)-$ 基(R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

10、

2) $R_1-B_4-CO-R_4-B_4'$ -基(R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2-R_4-B_4$ -基(D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

15 3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基(R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c)-基((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基(R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)

20 である。

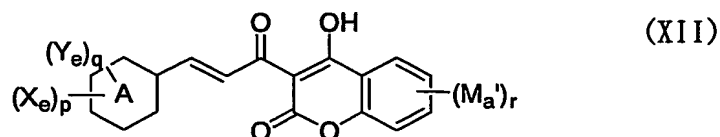
V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0の場合には p は2、3又は4である。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、
25 当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物。

12. 式 (XII)



[式中、

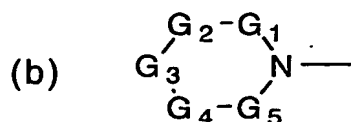
- 5 I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。
- II. $(X_e)_p$ において、 X_e は、水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、 $R'-S(O)_1$ -基 (R' は、C1-C10アルキル基を表し、1は0、1又は2を表す。)、シアノ基、 $HOCO-CH=CH$ -基、 $(R')_2N$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、 $R'CO-NH$ -基 (R' は、前記と同一の意味を表す。)、ニトロ基又はC1-C10アルコキシ基を表し、pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、 X_d は同一又は相異なる。
- 10 III. $(Y_e)_q$ において、 Y_e は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_5 群又は Y_5 群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、 Y_e は同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_e は、 Z_5 群の基をなして、A環と縮環してもよい。
- 15 (1) X_5 群：
- M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O
- 20

- R_d —基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ —基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ —基、 $R_eR_e'N-R_d$ —基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 5)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ —基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ —基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ —基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ —基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 10 は、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ —基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ —基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ —基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)
- 15 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_e —基 (X_e は、前記と同一の意味を表す。)を除く。

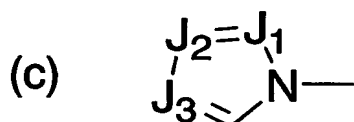
(2) Y_5 群:

- 20 M_b-R_d —基 [M_b は、 M_c —基 { M_c は、 M_d-R_d' —基 { M_d は、 M_a —基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a —基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a —基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は、

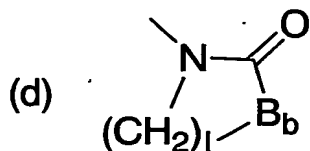


- 25 (b) —基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ば

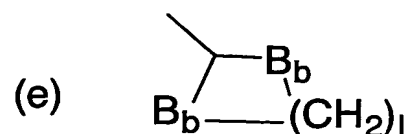
- れた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基（ R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1- 基（ R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。）で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。）で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基（ R_1 は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。）



(c) ー基（(c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。）



- 15 (d) ー基（ l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。）又は



- (e) ー基（ l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。）を表す。） M_c-B_a- 基（ M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。） M_c-CO- 基（ M_c は、前記と同一の意
- 20

- 味を表す。)、 M_c-CO-O -基(M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基(M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 5 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_5 群:

- $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。
 15)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)
 20 又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。))である。

但し、 p が0のとき、 Y_e は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキサール環をなすことはない。

IV. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

- 25 但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはない。

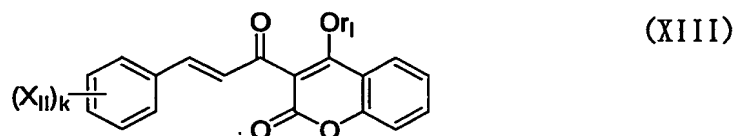
尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲

内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物。

5

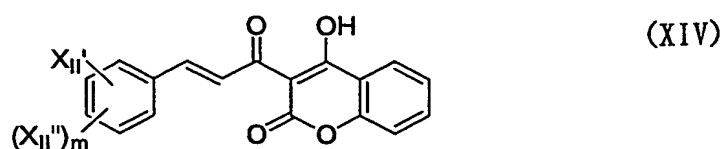
13. 式 (XIII)



[式中、 X_{II} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C3-C4アルコキシ基、又は、 R_I -S(O) $_1$ -基(R_I はC1-C4アルキル基を表し、 1 は0~2の整数を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、又は、(R_I) $_2$ N-基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 R_I -CO-NH-基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 R_I O-CO-NH-基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 R_I NH-CO-NH-基(R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、(R_I') $_2$ N-CO-基(R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、RB-基(Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。))を表し、 k は1~4の整数を表し、 k が2~4の整数の場合には X_{II} は相異なってよく、 r_I は、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基又はC2-C4アルキニル基を表す。]

20 で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物。

14. 式 (XIV)

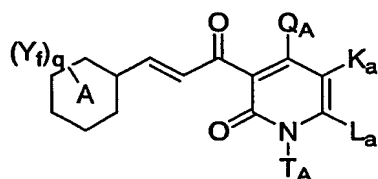


- [式中、 X_{II}' はハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されたC1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C3-C4アルコキシ基、 $R_{II}-S(O)_1$ -基 (R_{II} はC2-C4アルキル基を表し、1は0～2の整数を表す。)、シ
- 5 アノ基、カルボキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_{II})_2N$ -基 (R_{II} は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-CO-NH$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表す。)、 $R_I-O-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $R_I-NH-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、 $(R_I')_2N-CO$ -基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)又は RB -基(Bは酸素
- 10 原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_{II}'' は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基又はC3-C4アルコキシ基を表し、mは1又は2を表し、mが2の場合には X_{II}'' は相異なってよい。]

で示される2H-1-ベンゾピラン-2-オン化合物。

15. 式 (XV)

(XV)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_f)_q$ において、 Y_f は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又はY群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、

- 5 Y_f は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_f は、Z群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X群：

M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -

- 10 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O

- 15 $-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。

)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の

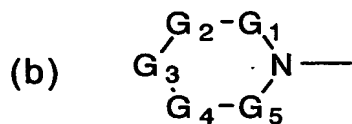
- 20 意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。]である。

10 (2) Y群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 M_d-R_d' -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよいナフチル基、又は

15 、

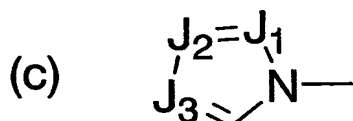


(b)-基 { (b)において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは

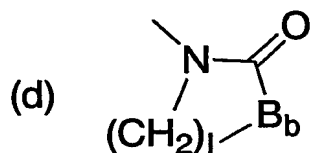
20 は $-NR_1$ -基 { R_1 は、水素原子、又は、 C_1-C_{10} アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、 C_1-C_{10} アルキル基、 C_3-C_{10} アルケニル基又は C_3-C_{10} アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換された C_2-C_{10} アルキル基、又は、 C_3-C_{10} アルケニル基、又は、 C_3-C_{10} アルキニル基を表す。} で置換されてもよい C_1-C_{10} アルキレン基、又は、

25 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい C_2-C_{10} アルケニレン

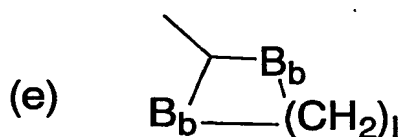
基を表す。}、



(c) ー基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) ー基 (l は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)
又は



(e) ー基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と
10 同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。 } を表す。 }、 M_c-B_a ー基 (M_c 及
び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO ー基 (M_c は、前記と同一の意
味を表す。)、 M_c-CO-O ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO
ー CO ー基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN ー基 (M_c 及び R_e は
、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同
15 一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意
味を表す。)、 M_cR_eN-CO ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、
 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ ー基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。
)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ ー基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の
意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記
20 と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ ー基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の

意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z群:

- (3) Z群: $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

- III. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) $-SO_2-B_c$ -基 ((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は R_1R_1' -N-基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ -基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。))を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。]を表す。]である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。))を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。))又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k-A_1N-(O)_k)$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一

一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N - (O)_n - A_1) -$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C (-OR_2) -$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $NH_2 - CS -$ 基である。

5 (v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 OSO_2 -$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) $A_3 - B_4 -$ 基

10 $[A_3$ は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m -$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b) - R_4 -$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4 -$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4 -$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4 -$ 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$ 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4 -$ 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4 -$ 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4 -$ 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N ((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

25 、

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B

₄は、前記と同一の意味を表す。）、

3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。）、

4) (b)-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。）、

5 5) (c)-基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。）又は

6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)である。

10 I V. T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)を表す。

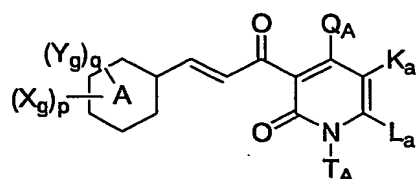
V. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

15 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

20 で示される2(1H)-ピリジノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

16. 式 (XVI)

(XVI)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. (X_g)_pにおいて、X_gは、水酸基、ハロゲン原子、(R')₂N-基 (R'は、C1-C10アルキル基を表す。)、ニトロ基又はC1-C10アルコキシ基を表し、
5 pは0、1、2、3又は4を表し、pが2以上のとき、X_gは同一又は相異なる。

III. (Y_g)_qにおいて、Y_gは、炭素原子上の置換基であって、下記のX_g群又はY_g群の基を表し、qは、0、1、2、3、4又は5を表し、qが2以上のとき、Y_gは同一又は相異なり、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なるY_gは、Z_g群の基をなして、A環と縮環してもよい。

10 (1) X_g群：

M_a-基 [M_aは、R_b-基 (R_bは、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、R_c-B_a-R_d-基 (R_cは、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、B_aは、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、R_dは、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、HOR_d-基 (R_dは、前記と同一の意味を表す。)]

15 R_e-CO-R_d-基 (R_eは、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、R_dは、前記と同一の意味を表す。)、R_e-CO-O-R_d-基 (R_e及びR_dは、前記と同一の意味を表す。)、R_eO-CO-R_d-基 (R_e及びR_dは、前記と同一の意味を表す。)、HO-CO-CH=CH-基、R_eR_c'N-R_d-基 (R_e及びR_c'は、同一又は相異なり、R_eは、前記と同一の意味を表し、R_c'は、R_eと同一の意味を表し、R_dは、前記と同一の意味を表す。)
20

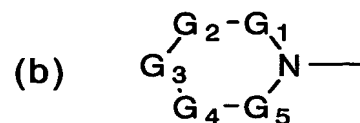
- $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

但し、Aがベンゼン環を表すとき、 X_g -基 (X_g は、前記と同一の意味を表す。)を除く。

15 (2) Y_6 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、又は

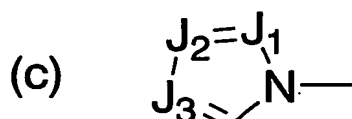
20 、



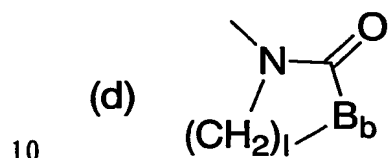
(b)-基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは

- 25 は $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-

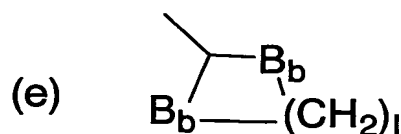
C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。)、



(c) -基 ((c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (1 は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) -基 (1 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。) を表す。)、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味

を表す。)、 $M_c R_e N-CO-$ 基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c R_e N-CO-NR_e'-$ 基(M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c R_e N-C(=NR_e')-NR_e''-$ 基(M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e-$ 基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 5 と同一の意味を表す。)又は $M_c R_e N-SO_2-$ 基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_6 群:

$-N=C(Y_a)-Y_a'-$ 基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ
 10 基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''-$ 基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)
 15 又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

IV. Q_A は、水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c-$ 基[A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)-$
 20 基(m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c-$ 基(A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c-$ 基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N-SO_2-B_c-$ 基(R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- SO_2-B_c- 基((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c-$ 基(A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を

表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基(B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c-B_c -基(M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基(D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基(D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基(D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基(A_4 は、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は $R_1R_1'N$ -基(R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基((b)及び R_4'

は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基(D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

5 (4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基(R_4 は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

15

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_{m'}$ -基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。))を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。]を表す。] である。

20

25 (ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$

) -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) である。

- 5 (iii) D_1 群: ($R_1-(O)_k-$) $A_1N-(O)_{k'}$ -基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS -基である。

- 10 (v) D_3 群: ニトロ基又は R_1OSO_2 -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) A_3-B_4 -基

- 15 [A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ -基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) - R_4 -基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - R_4 -基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (R_1 及び m は、前記と同一

の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチ
5 オ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) - 基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、

10 5) (c) - 基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。)又は

6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)である。

V. T_A は、水素原子、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c - 基 (M_c は、前記
15 と同一の意味を表す。)を表す。

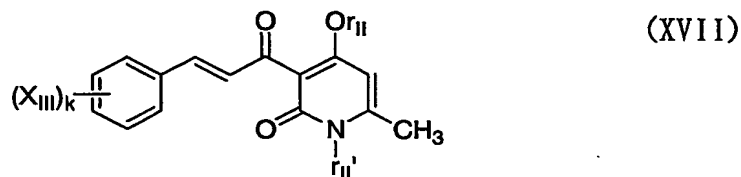
VI. K_a は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_b - 基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_a と L_a とはC1-C10アルキレン基をなすことがある。

但し、A環がベンゼン環のとき、 q が0となることはない。

20 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

25 で示される2(1H)-ピリジノン化合物。

17. 式 (XVII)

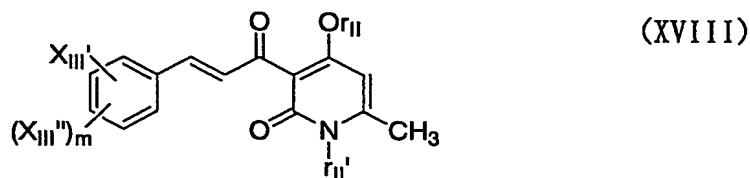


[式中、 X_{III} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 $R_I - S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、1は0~2の整数を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_I)_2N$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I O - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I NH - CO - NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 (R_I') ₂N-CO-基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、RB-基 (Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)]を表し、kは1~4の整数を表し、kが2~4の整数の場合には X_{III} は相異なってよく、 r_{III} 及び r_{III}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。

]

で示される2(1E)-ピリジノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

18. 式 (XVIII)



[式中、 $X_{III'}$ はC2-C4アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されたC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 $R_I-S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、1 は0～2の整数を表す。)、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、 $(R_{II})_2N$ -基 (R_{II} はC2-C4アルキル基を表す。)、又は、 $R_I-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-O-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-NH-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(R_I')_2N-CO$ -基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、 R

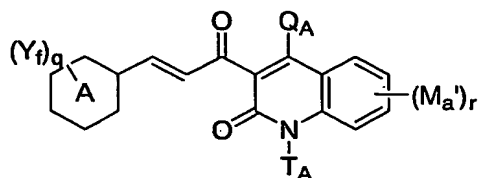
5 B-基 (Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 $X_{III''}$ は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、又は、C1-C4アルコキシ基を表し、mは1又は2を表し、mが2の場合には $X_{III''}$ は相異なってよく、 r_{II} 及び $r_{II'}$ は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。

15]

で示される2(1H)-ピリジノン化合物。

19. 式 (XIX)

(XIX)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(Y_f)_q$ において、 Y_f は、炭素原子上の置換基であって、下記のX群又はY群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、

- 5 Y_f は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_f は、Z群の基をなしてA環と縮環してもよい。

(1) X群：

M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -

- 10 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-O

- 15 $-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_c 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一

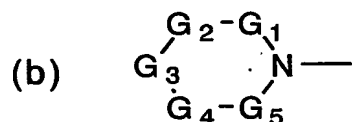
- 20 意味を表す。)

の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e'')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。] である。

10 (2) Y群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d' -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、又は

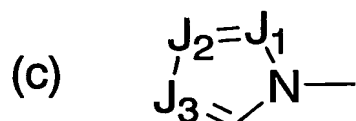
15 、



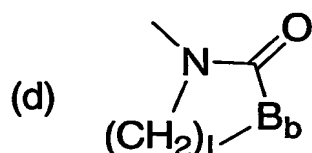
(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、 C_1-C_{10} アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、 C_1-C_{10} アルキル基、 C_3-C_{10} アルケニル基又は C_3-C_{10} アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)) で置換された C_2-C_{10} アルキル基、又は、 C_3-C_{10} アルケニル基、又は、 C_3-C_{10} アルキニル基を表す。} で置換されてもよい C_1-C_{10} アルキレン基、又は、
20 メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい C_2-C_{10} アルケニレン

25

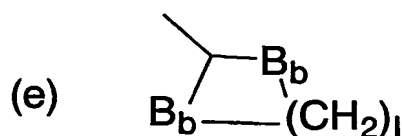
基を表す。}、



(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。)、



(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



(e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_cR_eN-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の

意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z群:

5 $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基 (Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O-$ 基 (Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

15 I I I. Q_A は、水酸基、(b) -基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_mR_1)$ -基 (mは、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1R_1'N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、(b) - SO_2-B_c -基 ((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基 (A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基 (B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)又は M_c-B_c -基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)である。

(1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基 ((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基 ((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 は、(b)-基 ((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基 ((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は $R_1R_1'N$ -基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基 ((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基 ((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

(5) A_7 ' ' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b)-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c)-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)) を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。] を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)-$ 基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)) を表す。]、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$ 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $R_1A_1N-N=C(R_3)-$ 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)) である。

(iii) D_1 群: $(R_1-(O)_k)-A_1N-(O)_k-$ 基 (R_1 及び A_1 は、前記と同一

一の意味を表し、 k 及び k' は、同一又は相異なり、0 又は 1 を表す。) である。

(iv) D_2 群: シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N - (O)_n - A_1) -$ 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C (-OR_2) -$ 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $NH_2 - CS -$ 基である。

5 (v) D_3 群: ニトロ基又は $R_1 OSO_2 -$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(vi) A_2 群:

1) $A_3 - B_4 -$ 基

10 $[A_3$ は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a - (R_4)_m -$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(b) - R_4 -$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4 -$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_1 - R_4 -$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4 -$ 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 -$ 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4 -$ 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4 -$ 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4 -$ 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N ((O)_m R_1) -$ 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。]

25 、

2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4' -$ 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4 -$ 基 (D_2 、 R_4 及び B_4

₄は、前記と同一の意味を表す。）、

3) $R_2-SO_2-NR_1$ -基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。）、

4) (b)-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。）、

5) (c)-基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

6) $R_1A_1N-NR_1'$ -基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。

IV. T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

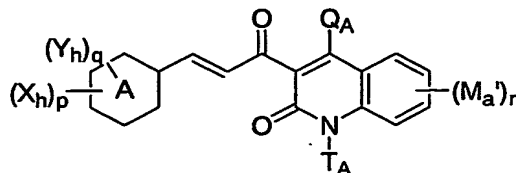
V. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は0、1、2、3又は4を表す。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される2(1H)-キノリノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

20. 式 (XX)

(XX)



[式中、

I. Aは、ベンゼン環又はピリジン環を表す。

II. $(X_h)_p$ において、 X_h は、水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシカルボニル基、 $(R')_2N$ -基(R' は、C1-C10アルキル基を表す。)、ニトロ基又はC1-C10アルコキシ基を表し、 p は0、1、2、3又は4を表し、 p が2以上のとき、 X_h は同一又は相異なる。但し、 p が2以上のとき、 X_h が水酸基、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基及びC1-C10アルコキシ基から選ばれる場合、 X_h は同時に同一の基又は原子を表すことはない。

III. $(Y_h)_q$ において、 Y_h は、炭素原子上の置換基であって、下記の X_7 群又は Y_7 群の基を表し、 q は、0、1、2、3、4又は5を表し、 q が2以上のとき、 Y_h は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_h は、 Z_7 群の基をなして、A環と縮環してもよい。

(1) X_7 群:

M_a -基 [M_a は、 R_b -基(R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 $R_c-B_a-R_d$ -基(R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基(R_d は、前記と同一の意味を表す。)

、 R_e-CO-R_d -基(R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基(R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基(R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基(R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)

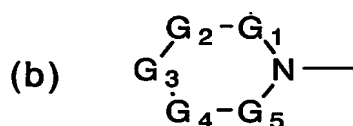
、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基(R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基(R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基(R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)

’ ’ は、同一又は相異なり、 R_c 及び R_e ’ は、前記と同一の意味を表し、 R_e ’ ’ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e$ ’ $N-C(=NR_e$ ’ ’) $-NR_e$ ’ ’ ’ $-R_d$ -基 (R_e 、 R_e ’、 R_e ’ ’ 及び R_e ’ ’ ’ は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e ’ 及び R_e ’ ’ は、前記と同一の意味を表し、 R_e ’ ’ ’ は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e$ ’ $N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e ’ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C_2-C_{10} アルケニル基又は C_2-C_{10} アルキニル基を表す。] である。

但し、 A がベンゼン環を表すとき、 X_h -基 (X_h は、前記と同一の意味を表す。)
10)を除く。

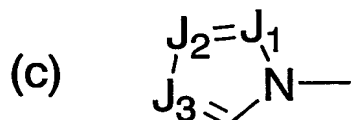
(2) Y_7 群:

M_b-R_d -基 [M_b は、 M_c -基 (M_c は、 M_d-R_d ’ -基 (M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、又は、
15



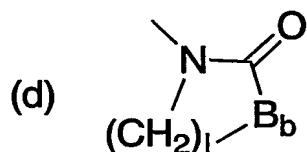
(b) -基 { (b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは
20 $-NR_1$ -基 (R_1 は、水素原子、又は、 C_1-C_{10} アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基 (R_2 は、 C_1-C_{10} アルキル基、 C_3-C_{10} アルケニル基又は C_3-C_{10} アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)) で置換された C_2-C_{10} アルキル基、又は、 C_3-C_{10} アルケニル基、又は、
25 C_3-C_{10} アルキニル基を表す。} で置換されてもよい C_1-C_{10} アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ -

基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C2-C10 アルケニレン基を表す。}、

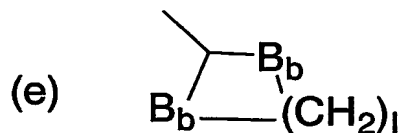


(c) -基 ((c) において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表す。) 、

5



(d) -基 (l は、2、3 又は 4 であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。) 又は



- 10 (e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 M_c-B_a -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_c-CO-O -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cO-CO -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cO-CO-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 M_cR_eN-CO -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-CO-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_cR_eN-C(=NR_e')-NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記
- 15
- 20

と同一の意味を表す。)又は $M_c R_e N-SO_2$ -基(M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

(3) Z_7 群:

5 $-N=C(Y_a)-Y_a'$ -基(Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表す。)
)、 $-Y_b-Y_b'-Y_b''$ -基(Y_b 及び Y_b'' は、同一又は相異なり、メチレン基、又は、オキシ基、又は、チオ基、又は、スルフィニル基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_b' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C4アルキレン基、又は、オキソ基を有してもよいC1-C4アルキレン基を表す。)又は $-Y_c-O-Y_c'-O$ -基(Y_c 及び Y_c' は、同一又は相異なり、C1-C10アルキレン基を表す。)である。

但し、 p が0のとき、 Y_h は、A環と縮環してベンゾ[1,3]ジオキサール環をなすことはない。

15 I V. Q_A :

水酸基、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 は、下記の A_7 群又は A_8 群の置換基を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基(m は、0又は1を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]
 20 $A_7''-SO_2-B_c$ -基(A_7'' は、下記の A_7'' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8-SO_2-B_c$ -基(A_8 は、下記の A_8 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N-SO_2-B_c$ -基(R_1 は前記と同一の意味を表し、 R_1' は R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、
 25 (b)- SO_2-B_c -基((b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9'-B_c$ -基(A_9' は、下記の A_7' 群又は A_8' 群の置換基を表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5-R_4-B_c$ -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を

表し、 B_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-B_3-B_c$ -基(B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。))又は M_c-B_c -基(M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。))である。

5 (1) A_7 群:

ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基(D_4 は、下記の D_4 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 は、下記の D_5 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基(D_1 は、下記の D_1 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4 -基((b)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4 -基((c)は、前記と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 は、下記の D_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基(D_3 は、下記の D_3 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基(A_4 は、(b)-基((b)は、前記と同一の意味を表す。)、(c)-基((c)は、前記と同一の意味を表す。))又は R_1R_1' -N-基(R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 は、下記の A_2 群の置換基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(2) A_8 群: 水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基である。

(3) A_7' 群: ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(b)- R_4' -基((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基((c)及び R_4' は、前記

と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4' -基(D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

(4) A_8' 群: C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基である。

- 5 (5) A_7'' 群: C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基(R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4' -基(D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基(D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基(D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、
10 (b)- R_4' -基((b)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、(c)- R_4' -基((c)及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基(D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 NO_2-R_4 -基(R_4 は、前記と同一の意味を表す。))又は A_2-CO-R_4 -基(A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)である。

- 15 (i) D_4 群: 水酸基又は A_1-O -基 [A_1 は、 $R_3-(CHR_0)_m-(B_2-B_3)_m$ -基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは R_2-B_1 -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニルを表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、前記と同一の意味を表し、 B_2 は、
20 単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_nR_1')$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。)を表し、 B_3 は、前記と同一の意味を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。}を表す。] である。

(ii) D_5 群: $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、

- 25 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 [R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_mR_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。))を表す。]、 D_2-R_4 -

O)_n-N=C(R₃)-基(D₂R₄、n及びR₃は、前記と同一の意味を表す。)
又はR₁A₁N-N=C(R₃)-基(R₁、A₁及びR₃は、前記と同一の意味を
表す。)である。

(iii)D₁群:(R₁-(O)_k-)A₁N-(O)_{k'}-基(R₁及びA₁は、前記と同一
5 一の意味を表し、k及びk'は、同一又は相異なり、0又は1を表す。)である。

(iv)D₂群:シアノ基、R₁R_{1'}NC(=N-(O)_n-A₁)-基(R₁、R_{1'}、
n、及びA₁は、前記と同一の意味を表す。)、A₁N=C(-OR₂)-基(A₁及
びR₂は、前記と同一の意味を表す。)又はNH₂-CS-基である。

(v)D₃群:ニトロ基又はR₁OSO₂-基(R₁は、前記と同一の意味を表す。)で
10 ある。

(vi)A₂群:

1)A₃-B₄-基

[A₃は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、
ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で
15 置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、R_a-(R₄)_m-基(R_aは、ハロゲ
ン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されても
よい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、R₄及びm
は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b)-R₄-基((b)及びR₄は、前記
と同一の意味を表す。)、(c)-R₄-基((c)及びR₄は、前記と同一の意味
20 を表す。)、R₂-B₁-R₄-基(R₂、B₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。
)、D₄-R₄-基(D₄及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₅-基(D₅は
、前記と同一の意味を表す。)、D₁-R₄-基(D₁及びR₄は、前記と同一の意味
を表す。)、D₂-基(D₂は、前記と同一の意味を表す。)、D₃-R₄-基(D₃
及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)若しくはA₄-SO₂-R₄-基{A₄は、
25 前記と同一の意味を表し、R₄は、前記と同一の意味を表す。}で置換されたC1-
C10アルキル基を表し、

B₄は、オキシ基、チオ基又は-N((O)_mR₁)-基(R₁及びmは、前記と同一
の意味を表す。)を表す。但し、B₄がチオ基のとき、A₃が水素原子ではない。]

、
 2) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

3) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

4) (b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

5) (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は

10 6) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) である。

V. T_A は、水素原子、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

15 VI. M_a' は、 M_a と同一又は相異なり、 M_a と同一の意味を表し、 r は 0、1、2、3 又は 4 を表す。

但し、A 環がベンゼン環のとき、 q が 0 となることはなく、A 環がベンゼン環又はピリジン環のいずれの場合も、 p と q は同時に 0 となることはない。

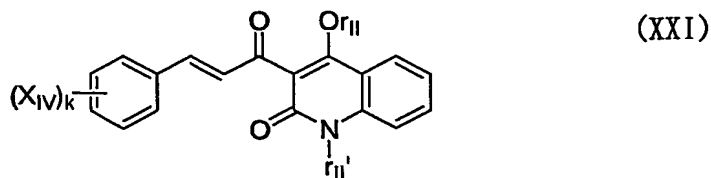
尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、

20 当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

で示される 2(1H)-ピリジノン化合物。

25

21. 式 (XXI)

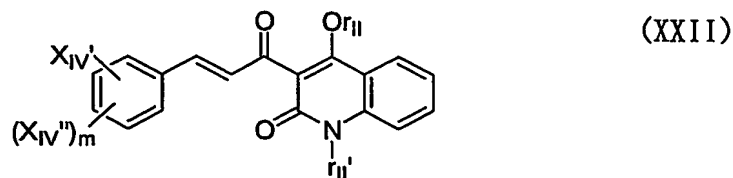


[式中、 X_{IV} は水素原子、又は、水酸基、又は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されてもよいC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C1-C4アルコキシ基、又は、 $R_I - S(O)_1$ - 基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、1は0～2の整数を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C1-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_I)_2 N$ - 基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I - CO - NH$ - 基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I O - CO - NH$ - 基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I NH - CO - NH$ - 基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 (R_I') $_2 N - CO$ - 基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、又は、 RB - 基 (Bは酸素原子又は硫黄原子を表し、Rはハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。))を表し、kは1～4の整数を表し、kが2～4の整数の場合には X_{IV} は相異なってもよく、 r_{III} 及び r_{III}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。

]

で示される2(1H)-キノリノン化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするI型コラーゲン遺伝子転写抑制組成物。

22. 式 (XXII)



[式中、 X_{IV}' はC2-C4アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはC1-C4アルコキシ基で置換されたC1-C4アルキル基、又は、C2-C4アルケニル基、又は、C2-C4アルキニル基、又は、C2-C4アルコキシ基、又は、 $R_I-S(O)_1$ -基 (R_I はC1-C4アルキル基を表し、 1 は0~2の整数を表す。)、又は、シアノ基、又は、カルボキシ基、又は、C2-C4アルコキシカルボニル基、又は、 $(R_{I1})_2N$ -基 (R_{I1} はC2-C4アルキル基を表す。)、又は、 $R_I-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-O-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $R_I-NH-CO-NH$ -基 (R_I は前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(R_I')_2N-CO$ -基 (R_I' は水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。)、

又は、 RB -基 (B は酸素原子又は硫黄原子を表し、 R はハロゲン原子で置換されたC1-C4アルキル基を表す。)を表し、 X_{IV}'' は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基又はC1-C4アルコキシ基を表し、 m は1又は2を表し、 m が2の場合には X_{IV}'' は相異なってよく、 r_{I1} 及び r_{I1}' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C4アルキル基を表す。

]

で示される2-(1H)-キノリノン化合物。

23. I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用。

24. I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導く

ことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用。

25. 請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする組織線維化改善組成物。

26. 有効量の請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法。

27. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用。

28. 請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とするTGF- β 作用抑制組成物。

29. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物の使用。

30. 請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする養毛組成物。

31. 有効量の請求項5、6、8、9、11、12、13、14、16、18、20又は22記載の化合物を、養毛処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法。

3 2. I型コラーゲン遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、請求項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用。

5

3 3. I型コラーゲン遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、請求項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用。

10

3 4. 請求項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする組織線維化改善組成物。

15 3 5. 有効量の請求項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法。

3 6. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、請求項1、2、3、
20 4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用。

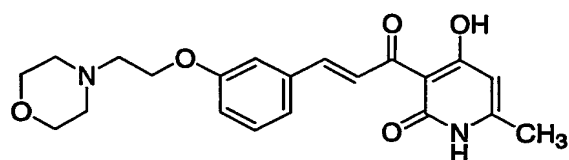
3 7. 請求項1、2、3、4、7、10、15、17、19又は21記載の組成物
25 3 8. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、請求項1、2、3、4、7

、 10、 15、 17、 19又は21記載の組成物に有効成分として含有される化合物の使用。

39. 請求項1、 2、 3、 4、 7、 10、 15、 17、 19又は21記載の組成物
5 に有効成分として含有される化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする養毛組成物。

40. 有効量の請求項1、 2、 3、 4、 7、 10、 15、 17、 19又は21記載
10 の組成物に有効成分として含有される化合物を、養毛処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法。

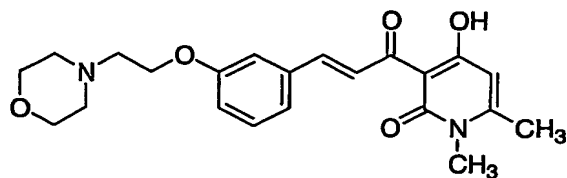
41. 式 (XXIII)



(XIII)

で示される2(1H)-ピリジノン化合物。

15 42. 式 (XXIV)



(XIV)

で示される2(1H)-ピリジノン化合物。

配列表

SEQUENCE LISTING

<110> Sumitomo Chemical Company Limited

<120> Cinnamoyl derivative and use thereof

<130> S10955W001

<150> JP 2003-324150

<151> 2003-09-17

<150> JP 2003-324155

<151> 2003-09-17

<150> JP 2003-324156

<151> 2003-09-17

<150> JP 2003-324157

<151> 2003-09-17

<160> 5

<210> 1

<211> 32

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

2/3

<220>

<223> Designed oligonucleotide primer to amplify collagen promoter DNA

<400> 1

ccaagctagc gaaattatct tttctttcat ag 32

<210> 2

<211> 28

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Designed oligonucleotide primer to amplify collagen promoter DNA

<400> 2

ccaaaagctt gcagtcgtgg ccagtacc 28

<210> 3

<211> 19

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Designed oligonucleotide primer to detect collagen DNA

<400> 3

3/3

atggtggcag ccagtttga 19

<210> 4

<211> 22

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Designed oligonucleotide primer to detect collagen DNA

<400> 4

caggtacgca atgctgttct tg 22

<210> 5

<211> 23

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Designed oligonucleotide probe to detect collagen DNA

<400> 5

ctcgcccttca tgcgccttget agc 23

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/013989

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D213/69, 309/38, 311/56, 413/10, 407/10, 215/22,
A61K31/366, 31/37, 31/4412, 31/4439, 31/4704, 31/5377,
7/06, A61P43/00, 17/14, 1/16, 11/00, 13/12, 17/02, 9/10, 9/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D213/69, 309/38, 311/56, 413/10, 407/10, 215/22,
A61K31/366, 31/37, 31/4412, 31/4439, 31/4704, 31/5377,
7/06

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2001-89412 A (Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.), 03 April, 2001 (03.04.01), Example 144 (Family: none)	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
A	JP 2002-371078 A (Sankyo Co., Ltd.), 26 December, 2002 (26.12.02), Table 2 (Family: none)	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
A	JP 2001-504080 A (Cornell Research Foundation, Inc.), 27 March, 2001 (27.03.01), & WO 96/22021 A1 & AU 9647586 A & EP 808103 A1	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
16 December, 2004 (16.12.04)

Date of mailing of the international search report
11 January, 2005 (11.01.05)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/013989

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2002-541253 A (SmithKline Beecham Corp.), 03 December, 2002 (03.12.02), & WO 00/61576 A1 & EP 1169317 A1 & EP 1169317 B1 & AT 231143 E & ES 2187473 T3 & US 6465493 B1	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	WO 01/79187 A2 (CYTOVIA, INC.), 25 October, 2001 (25.10.01), CAS RN: compounds of 369389-17-3, 369389-19-5, 369389-21-9, 369389-63-9, 369389-65-1 & WO 01/79187 A3 & US 2002/010169 A1 & EP 1324993 A2	6, 9 1-5, 7, 8, 10-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	RACHEDI, Y. et al., Synthesis of 4-hydroxy-6-methyl-3- β -arylpropionyl-2-pyrones by selective catalytic hydrogenation of 3-cinnamoyl-4-hydroxy-6-methyl-2-pyrones, Synthetic Communications, 1989, Vol.19, No.20, p.3437-42, CAS RN: compound of 128145-82-4 & Chemical abstracts 113:58843	6, 9 1-5, 7, 8, 10-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	JP 41-1412 B1 (Research Institute For Production Development), 03 February, 1966 (03.02.66), CAS RN: compound of 5169-90-4 (Family: none)	6 1-5, 7-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	JP 50-46666 A (Toray Industries, Inc.), 25 April, 1975 (25.04.75), CAS RN: compound of 57339-78-3 (Family: none)	14 1-13, 15-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	UKITA, Chunoshin et al., In vitro screening of tricarbonylmethane and related compounds for their antitumor effect by cylinder agar plate method, Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 1961, Vol.8, p.1016-20, CAS RN: compound of 94578-81-1 & Chemical abstracts 58:48844	14 1-13, 15-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	KALECHITS, G.V. et al., Synthesis and properties of 3-cinnamoyl-4-hydroxy-2-quinolone, Russian Journal of General Chemistry (Translation of Zhurnal Obshchei Khimii), 2001, Vol.71, No.8, pages 1257 to 1260, CAS RN: compound of 428818-04-6 & Chemical abstracts 136:401624	22 1-21, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
A	US 4017633 A (SMITHKLINE CORP.), 12 April, 1977 (12.04.77), (Family: none)	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/013989

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97/35565 A1 (Toray Industries, Inc.), 02 October, 1997 (02.10.97), & CA 2222471 AA & AU 9720436 A1 & AU 721881 B2 & EP 841063 A1 & CN 1194580 A & NO 9705439 A & US 6215016 B1	1-22,25,28, 30,34,37,39, 41,42
A	JP 3-503635 A (The Upjohn Co.), 15 August, 1991 (15.08.91), & WO 89/07939 A2 & WO 89/07939 A3 & AU 8940747 A1 & EP 403535 A1 & DK 9001956 A	1-22,25,28, 30,34,37,39, 41,42
A	JP 9-227547 A (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), 02 September, 1997 (02.09.97), (Family: none)	1-22,25,28, 30,34,37,39, 41,42
P,A	JP 2004-123621 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 22 April, 2004 (22.04.04), (Family: none)	1-3,10,11,13
P,A	JP 2004-123620 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 22 April, 2004 (22.04.04), (Family: none)	1-3,10,12,14
P,A	WO 03/080592 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 02 October, 2003 (02.10.03), & JP 2004-175780 A	1-5,7,8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/013989

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: (see extra sheet.)
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claims 23, 24, 26, 27, 29, 31 to 33, 35, 36, 38 and 40 relating to methods for treatment of the human body by therapy are described.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

The technical feature common to the inventions of claims 1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41 and 42 is compounds having as the partial structure ring structures represented by the general formula (i):

(i)

(wherein A is a benzene ring or a pyridine ring; and W_a is O or N), but compounds having such partial structures are publicly known (see, e.g., WO 01/79187 A2 (CYTOVIA, INC.) 25.October, 2001) (25.10.01).

(continued to extra sheet)

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/01398 9

Continuation of Box No.III of continuation of first sheet(2)

Such being the case, the inventions of claims 1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41 and 42 have no common technical feature beyond the prior art, and are therefore not so linked as to form a single general inventive concept.

(Concerning the scope of search)

·Claim 1 includes extremely many compounds as active ingredients of pharmaceutical compositions. However, few of the claimed compounds are supported by the description within the meaning of PCT Article 6 and disclosed within the meaning of PCT Article 5.

In this international search report, search has been made on the parts supported by the description and disclosed therein.

The same applies to claims 2-6, 10-12, 15, 16, 19, 20, 25, 28, 30, 34, 37 and 39.

·Search on claim 12 has been made, in view of the disclosure of the description, on the basis of the interpretation that the wording "with the proviso thatXc group.... are excluded" at the end in the definition of "group X₅" in claim 12 is an error and should be "with the proviso thatXe group.... are excluded".

Continuation of Box No.II-1 of continuation of first sheet(2)

Claims 23, 24, 26, 27, 29, 31-33, 35, 36, 38 and 40

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D213/69, 309/38, 311/56, 413/10, 407/10, 215/22, A61K31/366, 31/37, 31/4412, 31/4439, 31/4704, 31/5377, 7/06, A61P43/00, 17/14, 1/16, 11/00, 13/12, 17/02, 9/10, 9/12

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D213/69, 309/38, 311/56, 413/10, 407/10, 215/22, A61K31/366, 31/37, 31/4412, 31/4439, 31/4704, 31/5377, 7/06

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP 2001-89412 A(大塚製薬株式会社)2001.04.03, 例えば、実施例144参照(ファミリーなし)	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
A	JP 2002-371078 A(三共株式会社)2002.12.26, 例えば、表2参照(ファミリーなし)	1-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
(C欄の続きその1へ続く)		

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

16.12.2004

国際調査報告の発送日

11.1.2005

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

谷尾 忍

4P

9550

電話番号 03-3581-1101 内線 3491

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	(C欄の続きその1)	
A	JP 2001-504080 A(コーネル・リサーチ・ファンデーション・イン コーポレイテッド)2001.03.27 & WO 96/22021 A1 & AU 9647586 A & EP 808103 A1	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
A	JP 2002-541253 A(スミスクライン・ビーチャム・コーポレイショ ン)2002.12.03 & WO 00/61576 A1 & EP 1169317 A1 & EP 1169317 B1 & AT 231143 E & ES 2187473 T3 & US 6465493 B1	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
X A	WO 01/79187 A2(CYTOVIA, INC.)2001.10.25, CAS RN:369389-17- 3, 369389-19-5, 369389-21-9, 369389-63-9, 369389-65-1の化合 物参照 & WO 01/79187 A3 & US 2002/010169 A1 & EP 1324993 A2	6, 9 1-5, 7, 8, 10-2 2, 25, 28, 30, 3 4, 37, 39, 41, 4 2
X A	RACHEDI, Y. et al., Synthesis of 4-hydroxy-6-methyl-3- β -ary lpropionyl-2-pyrones by selective catalytic hydrogenation of 3-cinnamoyl-4-hydroxy-6-methyl-2- pyrones, Synthetic Commun ications, 1989, Vol.19, No.20, p.3437-42, CAS RN:128145-82-4 の化合物参照 & Chemical abstracts 113:58843	6, 9 1-5, 7, 8, 10-2 2, 25, 28, 30, 3 4, 37, 39, 41, 4 2
X A	JP 41-1412 B1(財団法人生産開発科学研究所)1966.02.03, CAS RN: 5169-90-4の化合物参照(ファミリーなし)	6 1-5, 7-22, 25, 28, 30, 34, 37, 39, 41, 42
X A	JP 50-46666 A(東レ株式会社)1975.04.25, CAS RN:57339-78-3の化 合物参照(ファミリーなし)	1 4 1-13, 15-22, 2 5, 28, 30, 34, 3 7, 39, 41, 42
X A	UKITA, Chunoshin et al., In vitro screening of tricarbonylme thane and related compounds for their antitumor effect by cy linder agar plate method, Chemical & Pharmaceutical Bulleti n, 1961, Vol.8, p.1016-20, CAS RN:94578-81-1の化合物参照 & Chemical abstracts 58:48844	1 4 1-13, 15-22, 2 5, 28, 30, 34, 3 7, 39, 41, 42
X A	KALECHITS, G. V. et al., Synthesis and properties of 3-cinna moyl-4-hydroxy-2-quinolone, Russian Journal of General Chemi stry(Translation of Zhurnal Obshchei Khimii), 2001, Vol.71, No.8, p.1257-1260, CAS RN:428818-04-6の化合物参照 & Chemical abstracts 136:401624	2 2 1-21, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
	(C欄の続きその2へ続く)	

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	(C欄の続きその2)	
A	US 4017633 A(SMITHKLINE CORP.)1977.04.12(ファミリーなし)	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
A	WO 97/35565 A1(東レ株式会社)1997.10.02 & CA 2222471 AA & AU 9720436 A1 & AU 721881 B2 & EP 841063 A1 & CN 1194580 A & NO 9705439 A & US 6215016 B1	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
A	JP 3-503635 A(ジ・アップジョン・カンパニー)1991.08.15 & WO 8 9/07939 A2 & WO 89/07939 A3 & AU 8940747 A1 & EP 403535 A1 & DK 9001956 A	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
A	JP 9-227547 A(三井東圧化学株式会社)1997.09.02(ファミリーなし)	1-22, 25, 28, 3 0, 34, 37, 39, 4 1, 42
PA	JP 2004-123621 A(住友化学工業株式会社)2004.04.22(ファミリーなし)	1-3, 10, 11, 13
PA	JP 2004-123620 A(住友化学工業株式会社)2004.04.22(ファミリーなし)	1-3, 10, 12, 14
PA	WO 03/080592 A1(住友化学工業株式会社)2003.10.02 & JP 2004-17 5780 A	1-5, 7, 8

第II欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 (特別ページ参照) は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、

請求の範囲 23、24、26、27、29、31-33、35、36、38及び40
には、人の治療方法に関する発明が記載されている。

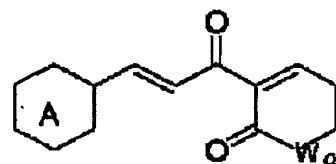
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

請求の範囲 1-22、25、28、30、34、37、39、41及び42記載の発明の共通する技術的特徴は、右記環構造〔式中、A：ベンゼン環又はピリジン環；W_α：O又はN〕を部分構造として有している化合物であるところ、前記部分構造を有する化合物は公知である (例えば、WO 01/79187 A2 (CYTOVIA, INC.) 2001.10.25参照)。



してみると、請求の範囲 1-22、25、28、30、34、37、39、41及び42記載の発明は、先行技術を越えた共通の技術的特徴を有していないものと認められるから、請求の範囲 1-22、25、28、30、34、37、39、41及び42記載の発明は、単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものではない。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

(調査範囲について)

・請求の範囲1は、医薬組成物の有効成分として非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかに過ぎない。

よって、本国際調査報告においては、明細書に裏付けられ、開示されている部分について調査を行った。

請求の範囲2～6、10～12、15、16、19、20、25、28、30、34、37及び39についても上記と同様に調査を行った。

・請求の範囲12の「X_a群」の定義の末尾の「但し、・・・X_c－基・・・を除く」は、明細書の記載を参酌して、「但し、・・・X_e－基・・・を除く」の誤記であると解釈した上で、請求の範囲12について調査を行った。

(第Ⅱ欄1. の請求の範囲の続き)

23、24、26、27、29、31－33、35、36、38及び40